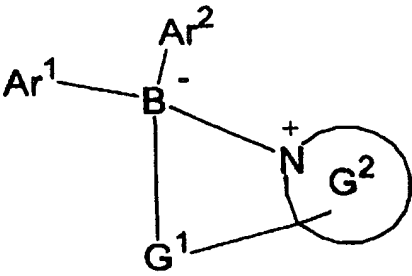




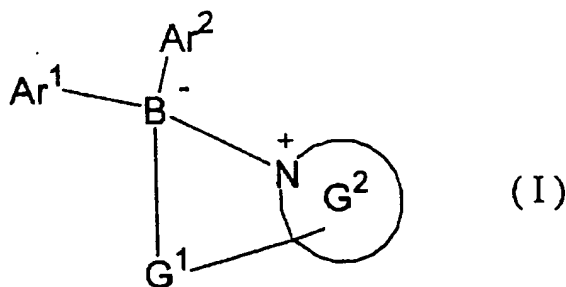
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

| | | |
|--|---|---|
| <p>(51) 国際特許分類7 A61K 31/69, A61P 33/02, C07F 5/02</p> | <p>A1</p> | <p>(11) 国際公開番号 WO00/44387</p> <p>(43) 国際公開日 2000年8月3日(03.08.00)</p> |
| <p>(21) 国際出願番号 PCT/JP99/07139</p> <p>(22) 国際出願日 1999年12月20日(20.12.99)</p> <p>(30) 優先権データ 特願平11/21822 1999年1月29日(29.01.99) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 日東化成株式会社(NITTO KASEI CO., LTD.)(JP/JP) 〒533-0031 大阪府大阪市東淀川区西淡路3丁目17番14号 Osaka, (JP) 塩野義製薬株式会社(SHIONOGI & CO., LTD.)(JP/JP) 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町三丁目1番8号 Osaka, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および (75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ) 今崎秀之(IMAZAKI, Hideyuki)(JP/JP) 〒618-0024 大阪府三島郡島本町若山台 2丁目2番20-102 Osaka, (JP) 藤川正澄(FUJIKAWA, Masazumi)(JP/JP) 〒630-8024 奈良県奈良市尼辻中町3-11-5 Nara, (JP) 早瀬善男(HAYASE, Yoshio)(JP/JP) 〒519-0105 三重県亀山市みずほ台14-177 Mie, (JP)</p> | <p>川口陽資(KAWAGUCHI, Harumoto)(JP/JP) 〒519-1402 三重県阿山郡伊賀町柘植町1421 Mie, (JP)</p> <p>(74) 代理人 青山 葆, 外(AOYAMA, Tamotsu et al.) 〒540-0001 大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル 青山特許事務所 Osaka, (JP)</p> <p>(81) 指定国 JP, US, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p> | |
| <p>(54)Title: ORGANOBORON COMPOUNDS EXHIBITING ANTICOCCIDIAL ACTIVITIES</p> <p>(54)発明の名称 抗コクシジウム活性を有する有機ボウ素化合物</p> <div style="text-align: center;">  <p>(I)</p> </div> <p>(57) Abstract Drug compositions for animals (except <i>Home sapiens</i>), antiprotozoal agents and anticoccidial agents, containing compounds represented by general formula (I), salts of the same, or hydrates of both, wherein Ar¹ and Ar² are each independently an optionally substituted cyclic group; G¹ is -A-, -A-CR¹R²-, or -A-CR³R⁴-CR⁵R⁶-; and G² is an optionally substituted azacyclic group (wherein the ring-constituting nitrogen atom is bonded to B) or the like, provided the ring composed of B, G¹ and G² is a five- or six-membered one.</p> | | |

(57)要約

本発明は一般式 (I) :



[式中、Ar¹およびAr²はそれぞれ独立して置換されていてもよい環式基；
G¹は、式：-A-、-A-CR¹R²-または-A-CR³R⁴-CR⁵R⁶-で
表される；G²は置換されていてもよいアザ環式基（ただし、環内窒素はB⁻と
結合している）等；なお、B⁻、G¹およびG²から構成される環は5員環または
6員環である] で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有
する動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

| | | | | | | | |
|----|--------------|----|---------|----|----------------|----|------------|
| AE | アラブ首長国連邦 | DM | ドミニカ | KZ | カザフスタン | RU | ロシア |
| AG | アンティグア・バーブーダ | DZ | アルジェリア | LC | セントルシア | SD | スーダン |
| AL | アルバニア | EE | エストニア | LI | リヒテンシュタイン | SE | スウェーデン |
| AM | アルメニア | ES | スペイン | LK | スリ・ランカ | SG | シンガポール |
| AT | オーストリア | FI | フィンランド | LR | リベリア | SI | スロヴェニア |
| AU | オーストラリア | FR | フランス | LS | レソト | SK | スロヴァキア |
| AZ | アゼルバイジャン | GA | ガボン | LT | リトアニア | SL | シエラ・レオネ |
| BA | ボスニア・ヘルツェゴビナ | GB | 英国 | LU | ルクセンブルグ | SN | セネガル |
| BB | バルバドス | GD | グレナダ | LV | ラトヴィア | SZ | スワジランド |
| BE | ベルギー | GE | グルジア | MA | モロッコ | TD | チャード |
| BF | ブルキナ・ファソ | GH | ガーナ | MC | モナコ | TG | トーゴ |
| BG | ブルガリア | GM | ガンビア | MD | モルドヴァ | TJ | タジキスタン |
| BJ | ベナン | GN | ギニア | MG | マダガスカル | TM | トルクメニスタン |
| BR | ブラジル | GR | ギリシャ | MK | マケドニア旧ユーゴスラヴィア | TR | トルコ |
| BY | ベラルーシ | GW | ギニア・ビサウ | | 共和国 | TT | トリニダード・トバゴ |
| CA | カナダ | HR | クロアチア | ML | マリ | TZ | タンザニア |
| CF | 中央アフリカ | HU | ハンガリー | MN | モンゴル | UA | ウクライナ |
| CG | コンゴ | ID | インドネシア | MR | モリタニア | UG | ウガンダ |
| CH | スイス | IE | アイルランド | MW | マラウイ | US | 米国 |
| CI | コートジボワール | IL | イスラエル | MX | メキシコ | UZ | ウズベキスタン |
| CM | カメルーン | IN | インド | MZ | モザンビーク | VN | ヴェトナム |
| CN | 中国 | IS | アイスランド | NE | ニジェール | YU | ユーゴスラヴィア |
| CR | コスタ・リカ | IT | イタリア | NL | オランダ | ZA | 南アフリカ共和国 |
| CU | キューバ | JP | 日本 | NO | ノールウェー | ZW | ジンバブエ |
| CY | キプロス | KE | ケニア | NZ | ニュー・ジーランド | | |
| CZ | チェコ | KG | キルギスタン | PL | ポーランド | | |
| DE | ドイツ | KP | 北朝鮮 | PT | ポルトガル | | |
| DK | デンマーク | KR | 韓国 | RO | ルーマニア | | |

明 細 書

抗コクシジウム活性を有する有機ホウ素化合物

5 発明の属する技術分野

本発明は獣医学の分野に属し、新規な動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤および抗コクシジウム剤を提供する。詳細には、本発明は有機ホウ素化合物を含有する組成物およびそれらの化合物に関する。

発明の背景

- 10 コクシジウム症は、原生動物（Apicomplexa門孢子虫綱）の一亜綱であるコクシジア（coccidia）による感染症である。コクシジア属であるアイメリア・テネラ（*Eimeria tenella*）、アイメリア・アセルブリーナ（*Eimeria acervulina*）およびアイメリア・ネカトリックス（*Eimeria necatrix*）などが主として家禽類に感染し、消化管出血、死あるいは成長抑制などの種々の症状を引き起こす。家禽類、例えばニワトリおよびアヒル等を営業上の目的で飼育している養鶏場においてコクシジウム症が集団発生すると極めて大きな損失をもたらし、しばしば深刻な問題となっている。従って、コクシジウム症の予防および治療に有効な抗コクシジウム剤に大きな関心が寄せられている。
- 15

従来技術および発明が解決しようとする課題

- 20 従来、抗コクシジウム剤としてはサルファ剤、ニトロフラン剤、キノリン剤、抗チアミン剤およびベンゾアミド類等が実用に供され、現在は主としてポリエーテル系抗生物質が使用されている。例えば、サリノマイシンやクロピドールが挙げられる。しかしながら、これらは主作用である抗コクシジウム作用の強度がさほど強くない上に、宿主に対する毒性に問題がある。また、薬剤の永年使用によって薬剤耐性株が出現し、そのために薬剤の効力が漸次低下するという事態が生起している。このような事情を考慮し、耐性株に有効であると同時に耐性を与え
- 25
- 難い新規な型の家禽用抗コクシジウム剤の開発が要望されている。

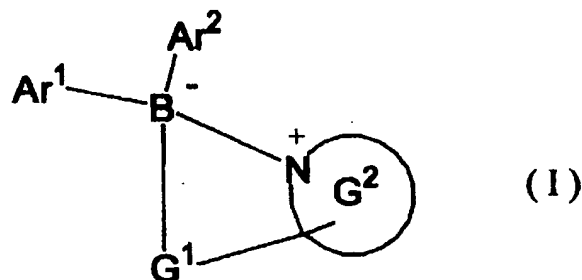
本発明者らは鋭意検討した結果、上記従来技術の欠点を克服し、優れた抗コクシジウム活性を有し、かつコクシジウム症の集団発生を防止することができる有

機ホウ素化合物を見出した。

- 有機ホウ素化合物として、Farfan, Norbertoら、J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2 (1992), (4), 527-32にはジフェニル (2-ピリジルアルキルオキシ-O, N) ボロン類およびその製造が記載され、またVershbitskii, F. R. ら、Term. Anal. Fazovye Ravnovesiya (1985), 31-3には分子内配位した有機ホウ素化合物が記載されているが、これら化合物の用途は一切記載されていない。そして Lin, Kaiら、Yiyao Gongye (1985), 16(11), 500-2には (p-フルオロフェニル) (o-メトキシフェニル) ボリネートと 8-ヒドロキシキノリンとを反応させ対応する置換フェニルを 2 つ有するホウ素含有環状物が記載され、これは抗腫瘍活性を示すことが記載されているが、問題の抗コキシウム作用については記載されていない。

課題を解決するための手段

すなわち、本発明は、一般式 (I) :

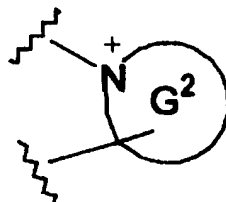


- [式中、Ar¹およびAr²はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

- G¹は、式：-A-、-A-CR¹R²-または-A-CR³R⁴-CR⁵R⁶-で表される基（式中、Aは酸素原子または硫黄原子、R¹~R⁶はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、-O-（置換されていてもよい脂肪族炭化水素基）、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、またはR¹とR²、R³とR⁴および／もしくはR⁵とR⁶が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形

成する) ;

式 :



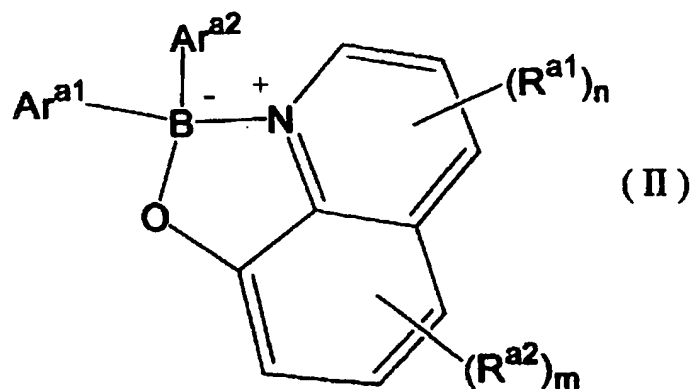
で示される基は置換されていてもよいアザ環式基 ;

- 5 ただし、 B^- 、 G^1 および G^2 から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

- 10 別の態様として、本発明は上記式 (I) で示される化合物中、以下に示す化合物を包含する :

1) 一般式 (II) :



[式中、 Ar^1 は、置換されていてもよいアリール基 ;

Ar^2 は置換されていてもよい縮合アリール基 ;

- 15 R^1 および R^2 はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され

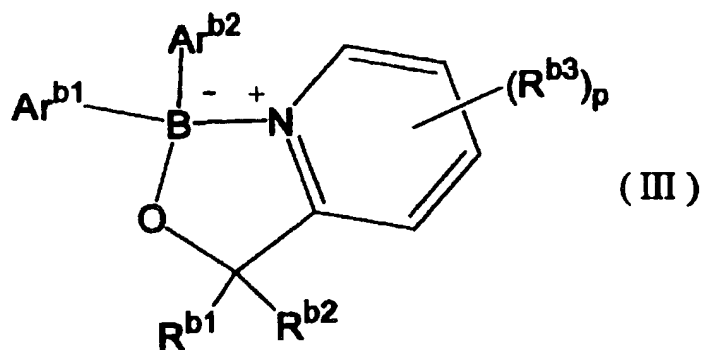
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基；

n および m は同一または異なって 0 ～ 3 のいずれかの整数を示す。

ただし、n および m がともに 0 であるとき、 Ar^{b1} および Ar^{b2} がともに 1 位がナフタレン-1-イルで置換されているナフタレン-2-イルである場合を除く。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；

2) 一般式 (III)：



[式中、 Ar^{b1} および Ar^{b2} は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

R^{b1} および R^{b2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^{b1} と R^{b2} が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R^{b3} はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ

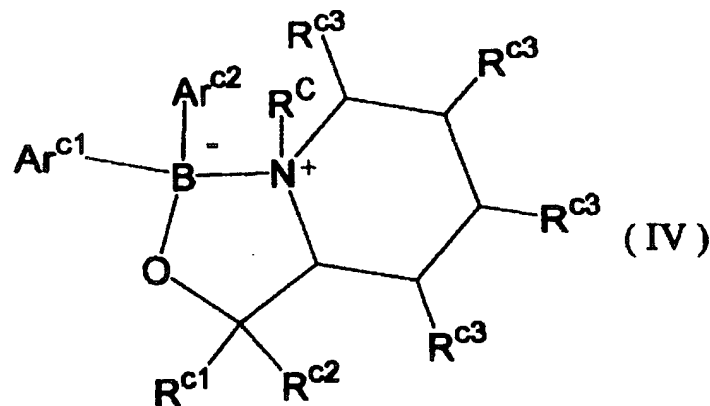
基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

p は 0 ～ 4 のいずれかの整数を示す。

ただし、p が 0、 R^{b1} および R^{b2} がともに水素ならびに Ar^{b1} および Ar^{b2} がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、 Ar^{b1} および Ar^{b2} における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；

3) 一般式 (IV) :



[式中、 Ar^{c1} および Ar^{c2} はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

R^{c1} および R^{c2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または

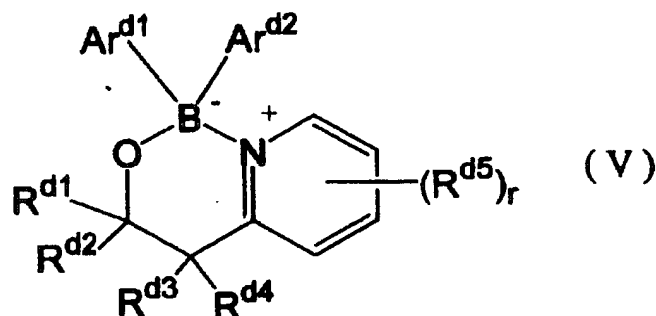
R^{c1} と R^{c2} が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R^{c3} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

R^c は水素原子または低級アルキルを示す]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物；および

4) 一般式 (V)：



[式中、 Ar^{d1} および Ar^{d2} は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} および R^{d4} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^{d1} と R^{d2} および／または R^{d3} と R^{d4} が一緒になってオキシ、置換され

ていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R^{d5} はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

10 r は0～4のいずれかの整数を示す。

ただし、 r が0、 R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} および R^{d4} がすべて水素ならびに Ar^{d1} および Ar^{d2} がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、 Ar^{d1} および Ar^{d2} における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]

15 で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

上記式中、 Ar^1 および Ar^2 で示される「置換されていてもよい環式基」とは、例えば単環式または縮合多環式の脂環式炭化水素基（例、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよいシクロアルカジエニル基等）、単環式または縮合多環式の芳香族炭化水素基（例、置換されていてもよいアリール基等）、単環式または縮合多環式の複素環基（例、置換されていてもよい芳香族複素環基等）、スピロ環式の炭化水素基または複素環基等をいう。

好ましくは、 Ar^1 および Ar^2 は同一である。

上記のシクロアルキル基の例としては、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビスクロ

25 [2. 2. 1] ヘプチル、ビスクロ [2. 2. 2] オクチル、ビスクロ [3. 2. 1] オクチル、ビスクロ [3. 2. 2] ノニル、ビスクロ [3. 3. 1] ノニル、ビスクロ [4. 2. 1] ノニル、ビスクロ [4. 3. 1] デシル、アダマンチル等の炭素数3ないし20のシクロアルキル基等が挙げられる。

上記のシクロアルケニル基の例としては、例えば2-シクロペンテン-1-イル、3-シクロペンテン-1-イル、2-シクロヘキセン-1-イル、3-シクロヘキセン-1-イル等の炭素数4ないし20のシクロアルケニル基等が挙げられる。

5 上記のシクロアルカジエニル基の例としては、例えば2, 4-シクロペンタジエン-1-イル、2, 4-シクロヘキサジエン-1-イル、2, 5-シクロヘキサジエン-1-イル等の炭素数4ないし20のシクロアルカジエニル基等が挙げられる。

10 上記の「アリール基」としては、例えばフェニル、インデニル、ナフチル（1-ナフチル、2-ナフチル等）、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル、フルオレニル（9-フルオレニル、1-フルオレニル等）等の炭素数6ないし20のアリール基等が挙げられる。

15 上記の「複素環基」としては、環系を構成する原子として酸素、硫黄、窒素の少なくとも1個のヘテロ原子を含有する複素環基を意味し、単環式複素環基または縮合多環式複素環基が挙げられる。

20 単環式複素環基の具体例としては、例えばイソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、オキサゾリル、フラザニル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、チアゾリル、チエニル、テトラゾリル、トリアジニル、1, 2, 3-トリアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピロリル、2H-ピロリル、フラザニル、フリル等が挙げられる。

25 縮合多環式複素環基の具体例としては、例えばアクリジニル、5-アザベンゾ [a] アントラセニル、イソインドリル、イソキノリル、イソクロマニル、イソベンゾフラニル、イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル、4H-イミダゾ [4, 5-d] チアゾリル、イミダゾ [1, 2-b] [1, 2, 4] トリアジニル、イミダゾ [1, 2-a] ピリジル、イミダゾ [1, 5-a] ピリジル、イミダゾ [1, 2-b] ピリダジニル、イミダゾ [1, 2-a] ピリミジニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、1H-インダゾリル、インドリジニル、インドリル、4H

[1, 3] -オキサチオロ [5, 4-b] ピロリル、1H-2-オキサピレニル、
 カルバゾリル、 α -カルボリニル、 β -カルボリニル、 γ -カルボリニル、キナ
 ゾリニル、キノキサリニル、キノリル、クロマニル、4H-1, 3-ジオキソロ
 [4, 5-b] イミダゾリル、シクロペンタ [b] ピラニル、2, 3-ジチア-
 5 1, 5-ジアザインダニル、4H-1, 3-ジチアナフタレニル、1, 4-ジチ
 アナフタレニル、シンノニル、チアントレニル、チエノ [2, 3-b] フラニル、
 2, 7, 9-トリアザフェナントレニル、1, 2, 4-トリアゾロ [4, 3-
 a] ピリダジニル、1, 2, 4-トリアゾロ [4, 3-a] ピリジル、2, 4,
 6-トリチア-3a, 7a-ジアザインダニル-ナフチリジニル、ピペラジニル、
 10 ピペリジル、ピラゾリジニル、7H-ピラジノ [2, 3-c] カルバゾリル、ピ
 ラジノ [2, 3-d] ピリダジニル、1H-ピラゾロ [4, 3-d] オキサゾリ
 ル、ピラゾロ [1, 5-a] ピリジル、ピリド [1', 2': 1, 2] イミダ
 ゾ [4, 5-b] キノキサリニル、5H-ピリド [2, 3-d] -o-オキサジ
 ニル、4H-ピリド [2, 3-c] カルバゾリル、ピロリジニル、ピロリニル、
 15 1H-ピロロ [1, 2-b] [2] ベンゾアゼピニル、ピロロ [1, 2-b] ピ
 リダジニル、フェナジニル、フェナトリジニル、フェナトロリニル、フェノキサ
 ジニル、フェノキサチイニル、フェノチアジニル、フタラジニル、プテリジニル、
 プリニル、2H-フロ [3, 2-b] ピラニル、フロ [3, 4-c] シンシノリ
 ニル、1, 2-ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾ [h] イソクノリル、1, 2-
 20 ベンゾイソチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、4H-3,
 1-ベンゾオキサジニル、3-ベンゾオキセピニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾ
 [b] チエニル、1H-ベンゾトリアゾリル、ベンゾ [b] フラニル、モルホリ
 ニル、等が挙げられる。

Ar¹およびAr²で示される「置換されていてもよい環式基」として好まし
 25 い基は置換されていてもよいアリール基であり、詳細には例えば、ハロゲン原子、
 低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルキ
 ル基、ハロゲン化低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ヒドロキシ
 基、アシル基、アミノ基等によって置換されていてもよいアリール基が挙げられ
 る。なお、Ar¹およびAr²におけるアリール基または複素環基の置換基の数

「ハロゲン原子」とは、例えばフッ素、塩素、臭素等を表す。

よって、上記のハロゲン原子で置換されたアリール基としては、例えば2-ハロゲン化フェニル（例、2-フロロフェニル、2-クロロフェニル、2-ブロモフェニル等）、3-ハロゲン化フェニル（例、3-フロロフェニル、3-クロロフェニル、3-ブロモフェニル等）、4-ハロゲン化フェニル（例、4-フロロフェニル、4-クロロフェニル、4-ブロモフェニル等）、2-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、2-フロロナフタレン-1-イル、2-クロロナフタレン-1-イル、2-ブロモナフタレン-1-イル等）、3-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、3-フロロナフタレン-1-イル、3-クロロナフタレン-1-イル、3-ブロモナフタレン-1-イル等）、4-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4-フロロナフタレン-1-イル、4-クロロナフタレン-1-イル、4-ブロモナフタレン-1-イル等）、5-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、5-フロロナフタレン-1-イル、5-クロロナフタレン-1-イル、5-ブロモナフタレン-1-イル等）、6-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、6-フロロナフタレン-1-イル、6-クロロナフタレン-1-イル、6-ブロモナフタレン-1-イル等）、7-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、7-フロロナフタレン-1-イル、7-クロロナフタレン-1-イル、7-ブロモナフタレン-1-イル等）、8-ハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、8-フロロナフタレン-1-イル、8-クロロナフタレン-1-イル、8-ブロモナフタレン-1-イル等）、1-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、1-フロロナフタレン-2-イル、1-クロロナフタレン-2-イル、1-ブロモナフタレン-2-イル等）、3-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、3-フロロナフタレン-2-イル、3-クロロナフタレン-2-イル、3-ブロモナフタレン-2-イル等）、4-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、4-フロロナフタレン-2-イル、4-クロロナフタレン-2-イル、4-ブロモナフタレン-2-イル等）、5-ハロゲン化ナフタレン-2-イル（例、5-フロロナフタレン

- ー2-イル、5-クロロナフタレン-2-イル、5-ブロモナフタレン-2-イル等)、6-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、6-フロロナフタレン-2-イル、6-クロロナフタレン-2-イル、6-ブロモナフタレン-2-イル等)、7-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、7-フロロナフタレン-2-イル、7-クロロナフタレン-2-イル、7-ブロモナフタレン-2-イル等)、
- 5 8-ハロゲン化ナフタレン-2-イル(例、8-フロロナフタレン-2-イル、8-クロロナフタレン-2-イル、8-ブロモナフタレン-2-イル等)、2-ハロゲン化インデン-1-イル(例、2-フロロインデン-1-イル、2-クロロインデン-1-イル、2-ブロモインデン-1-イル等)、3-ハロゲン化イン
- 10 デン-1-イル(例、3-フロロインデン-1-イル、3-クロロインデン-1-イル、3-ブロモインデン-1-イル等)、4-ハロゲン化インデン-1-イル(例、4-フロロインデン-1-イル、4-クロロインデン-1-イル、4-ブロモインデン-1-イル等)、5-ハロゲン化インデン-1-イル(例、5-フロロインデン-1-イル、5-クロロインデン-1-イル、5-ブロモイン
- 15 デン-1-イル等)、6-ハロゲン化インデン-1-イル(例、6-フロロインデン-1-イル、6-クロロインデン-1-イル、6-ブロモインデン-1-イル等)、7-ハロゲン化インデン-1-イル(例、7-フロロインデン-1-イル、7-クロロインデン-1-イル、7-ブロモインデン-1-イル等)、1-ハロ
- 20 ゲン化インデン-2-イル(例、1-フロロインデン-2-イル、1-クロロインデン-2-イル、1-ブロモインデン-2-イル等)、3-ハロゲン化インデン-2-イル(例、3-フロロインデン-2-イル、3-クロロインデン-2-イル、3-ブロモインデン-2-イル等)、4-ハロゲン化インデン-2-イル(例、4-フロロインデン-2-イル、4-クロロインデン-2-イル、4-ブロモインデン-2-イル等)、5-ハロゲン化インデン-2-イル(例、5-フロロインデン-2-イル、5-クロロインデン-2-イル、5-ブロモインデン-2-イル等)、6-ハロゲン化インデン-2-イル(例、6-フロロインデン-2-イル、6-クロロインデン-2-イル、6-ブロモインデン-2-イル等)、7-ハロゲン化インデン-2-イル(例、7-フロロインデン-2-イル、7-クロロインデン-2-イル、7-ブロモインデン-2-イル等)、7-ハロ
- 25

ゲン化インデン-4-イル（例、7-フロロインデン-4-イル、7-クロロインデン-4-イル、7-ブロモインデン-4-イル等）、5-ハロゲン化インデン-3-イル（例、5-フロロインデン-3-イル、5-クロロインデン-3-イル、5-ブロモインデン-3-イル等）、3-ハロゲン化インデン-5-イル（例、3-フロロインデン-5-イル、3-クロロインデン-5-イル、3-ブロモインデン-5-イル等）、2-ハロゲン化インデン-6-イル（例、2-フロロインデン-6-イル、2-クロロインデン-6-イル、2-ブロモインデン-6-イル等）、4-ハロゲン化インデン-7-イル（例、4-フロロインデン-7-イル、4-クロロインデン-7-イル、4-ブロモインデン-7-イル等）、1-ハロゲン化インデン-4-イル（例、1-フロロインデン-4-イル、1-クロロインデン-4-イル、1-ブロモインデン-4-イル等）、2, 3-ジハロゲン化フェニル（例、2, 3-ジフルオロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 3-ジブロモフェニル等）、2, 3-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、2, 3-ジフルオロナフタレン-1-イル、2, 3-ジクロロナフタレン-1-イル、2, 3-ジブロモナフタレン-1-イル等）、2, 4-ジハロゲン化フェニル（例、2, 4-ジフルオロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 4-ジブロモフェニル等）、2, 6-ジハロゲン化フェニル（例、2, 6-ジフルオロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジブロモフェニル等）、4, 5-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 5-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 5-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 5-ジブロモナフタレン-1-イル等）、4, 6-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 6-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 6-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 6-ジブロモナフタレン-1-イル等）、4, 8-ジハロゲン化ナフタレン-1-イル（例、4, 8-ジフルオロナフタレン-1-イル、4, 8-ジクロロナフタレン-1-イル、4, 8-ジブロモナフタレン-1-イル等）等が挙げられる。このように、それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-, 3-, 4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-があり特に限定されない。

上記の「低級アルキル」としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソブ

ロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし10のアルキル基等が挙げられる。

5 なお、本明細書中、「低級」なる用語は、別に定めのない限り、アルキル基、アルケニル基等の脂肪族炭化水素基中の炭素原子数が1～10、好ましくは1～8、さらに好ましくは1～6を示すものとする。

よって、上記の低級アルキルで置換されたアリール基としては、例えば2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、2-メチルナフタレン-1-イル、
10 3-メチルナフタレン-1-イル、4-メチルナフタレン-1-イル、5-メチルナフタレン-1-イル、6-メチルナフタレン-1-イル、7-メチルナフタレン-1-イル、8-メチルナフタレン-1-イル、2, 4-ジメチルフェニル、2, 4, 6-トリメチルフェニル、4, 5-ジメチルナフタレン-1-イル、4, 6-ジメチルナフタレン-1-イル、4, 8-ジメチルナフタレン-1-イル、
15 2-メチルインデン-1-イル、3-メチルインデン-1-イル、4-メチルインデン-1-イル、5-メチルインデン-1-イル、6-メチルインデン-1-イル、7-メチルインデン-1-イル、1-メチルインデン-2-イル、3-メチルインデン-2-イル、4-メチルインデン-2-イル、5-メチルインデン-2-イル、6-メチルインデン-2-イル、7-メチルインデン-2-イル、
20 1-メチルインデン-3-イル、2-メチルインデン-3-イル、4-メチルインデン-3-イル、5-メチルインデン-3-イル、6-メチルインデン-3-イル、7-メチルインデン-3-イル、1-メチルインデン-4-イル、2-メチルインデン-4-イル、3-メチルインデン-4-イル、5-メチルインデン-4-イル、6-メチルインデン-4-イル、7-メチルインデン-4-イル、
25 1-メチルインデン-5-イル、2-メチルインデン-5-イル、3-メチルインデン-5-イル、4-メチルインデン-5-イル、6-メチルインデン-5-イル、7-メチルインデン-5-イル、1-メチルインデン-6-イル、2-メチルインデン-6-イル、3-メチルインデン-6-イル、4-メチルインデン-6-イル、5-メチルインデン-6-イル、7-メチルインデン-6-イル、

1-メチルインデン-7-イル、2-メチルインデン-7-イル、3-メチルインデン-7-イル、4-メチルインデン-7-イル、5-メチルインデン-7-イル、6-メチルインデン-7-イル等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-, 3-, 4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-があり特に限定されない。

上記の「低級アルケニル基」としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし10のアルケニル基が挙げられる。

よって、上記の低級アルケニルで置換されたアリール基としては、例えば、2-ビニルフェニル、3-ビニルフェニル、4-ビニルフェニル、2-アリルフェニル、3-アリルフェニル、4-アリルフェニル、2-ビニルナフタレン-1-イル、3-ビニルナフタレン-1-イル、4-ビニルナフタレン-1-イル、5-ビニルナフタレン-1-イル、6-ビニルナフタレン-1-イル、7-ビニルナフタレン-1-イル、8-ビニルナフタレン-1-イル、2-ビニルインデン-1-イル、3-ビニルインデン-1-イル、4-ビニルインデン-1-イル、5-ビニルインデン-1-イル、6-ビニルインデン-1-イル、7-ビニルインデン-1-イル、1-ビニルインデン-2-イル、3-ビニルインデン-2-イル、4-ビニルインデン-2-イル、5-ビニルインデン-2-イル、6-ビニルインデン-2-イル、7-ビニルインデン-2-イル、1-ビニルインデン-3-イル、2-ビニルインデン-3-イル、4-ビニルインデン-3-イル、5-ビニルインデン-3-イル、6-ビニルインデン-3-イル、7-ビニルインデン-3-イル、1-ビニルインデン-4-イル、2-ビニルインデン-4-イル、3-ビニルインデン-4-イル、5-ビニルインデン-4-イル、6-ビニルインデン-4-イル、7-ビニルインデン-4-イル、1-ビニルインデン-5-イル、2-ビニルインデン-5-イル、3-ビニルインデン-5-イル、4-ビニルインデン-5-イル、6-ビニルインデン-5-イル、7-ビニルイ

ンデン-5-イル、1-ビニルインデン-6-イル、2-ビニルインデン-6-イル、3-ビニルインデン-6-イル、4-ビニルインデン-6-イル、5-ビニルインデン-6-イル、7-ビニルインデン-6-イル、1-ビニルインデン-7-イル、2-ビニルインデン-7-イル、3-ビニルインデン-7-イル、
5 4-ビニルインデン-7-イル、5-ビニルインデン-7-イル、6-ビニルインデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記の「低級アルコキシ基」としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、ネオブトキシ、t-ブトキシ、ペントキシ、イソペントキシ等の炭素数1ないし10のアルコキシ基が挙げられる。

10 よって、上記の低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えば2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、2-メトキシナフタレン-1-イル、3-メトキシナフタレン-1-イル、4-メトキシナフタレン-1-イル、5-メトキシナフタレン-1-イル、6-メトキシナフタレン-1-イル、7-メトキシナフタレン-1-イル、8-メトキシナフタレン-1-イル、2,4-ジメトキシフェニル、2,4,6-トリメトキシフェニル、4,5-ジメトキシナフタレン-1-イル、4,6-ジメトキシナフタレン-1-イル、4,8-ジメトキシナフタレン-1-イル、1-メトキシインデン-2-イル、1-メトキシインデン-3-イル、1-メトキシインデン-4-イル、1-メトキシインデン-5-イル、1-メトキシインデン-6-イル、1-メトキシインデン-7-イル、1,3-ジメトキシインデン-2-イル、1,2-ジメトキシインデン-3-イル、1,3-ジメトキシインデン-4-イル、2,3-ジメトキシインデン-5-イル、1,4-ジメトキシインデン-6-イル、1,4-ジメトキシインデン-7-イル等が挙げられる。

25 上記の「ハロゲン化低級アルキル」としては、例えばフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、1-フルオロエチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、1,2-ジフルオロエチル、1,2-ジクロロエチル、

1, 2-ジブロモエチル、1, 1-ジフルオロエチル、1, 1-ジクロロエチル、
1, 1-ジブロモエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロエチル、
2, 2-ジブロモエチル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルキル基
が挙げられる。

- 5 よって、上記のハロゲン化低級アルキル基で置換されたアリール基としては、
例えばハロメチルで置換されたアリール基（例、フルオロメチルで置換されたフェ
ニル基、フルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメチルで
置換されたフェニル基、クロロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、プロ
モメチルで置換されたフェニル基、プロモメチルで置換されたナフタレン-1-
10 イル等）、2-ハロエチルで置換されたアリール基（例、2-フルオロエチルで
置換されたフェニル基、2-フルオロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、
2-クロロエチルで置換されたフェニル基、2-クロロエチルで置換されたナフ
タレン-1-イル、2-ブロモエチルで置換されたフェニル基、2-ブロモエチ
ルで置換されたナフタレン-1-イル等）、1-ハロエチルで置換されたアリ
15 ル基（例、1-フルオロエチルで置換されたフェニル基、1-フルオロエチルで
置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロエチルで置換されたフェニル基、
1-クロロエチルで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモエチルで置換
されたフェニル基、1-ブロモエチルで置換されたナフタレン-1-イル等）、
トリハロメチルで置換されたアリール基（例、トリフルオロメチルで置換された
20 フェニル基、トリフルオロメチルで置換されたナフタレン-1-イル、トリクロ
ロメチルで置換されたフェニル基、トリクロロメチルで置換されたナフタレン-
1-イル、トリプロモメチルで置換されたフェニル基、トリプロモメチルで置換
されたナフタレン-1-イル等）等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、
フェニル基であれば、2-, 3-, 4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2
25 -, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-があり特に限定されない。

インデニルであれば、例えば1-フルオロメチルインデン-2-イル、1-ク
ロロメチルインデン-2-イル、1-プロモメチルインデン-2-イル、1-
(2-フルオロエチル) インデン-2-イル、1-(2-クロロエチル) インデ
ン-2-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-2-イル、1-(1-フル

- オロエチル) インデン-2-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-2-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-2-イル、1-トリフルオロメチルインデン-2-イル、1-トリクロロメチルインデン-2-イル、1-トリプロモメチルインデン-2-イル、1-フルオロメチルインデン-3-イル、1-クロ
5 ロメチルインデン-3-イル、1-ブロモメチルインデン-3-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-3-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-3-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-3-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-3-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-3-イル、
1-(1-ブロモエチル) インデン-3-イル、1-トリフルオロメチルインデ
10 ン-3-イル、1-トリクロロメチルインデン-3-イル、1-トリプロモメチルインデン-3-イル、1-フルオロメチルインデン-4-イル、1-クロロメチルインデン-4-イル、1-ブロモメチルインデン-4-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-4-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-4-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-4-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-4-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-4-イル、1-
15 (1-ブロモエチル) インデン-4-イル、1-トリフルオロメチルインデン-4-イル、1-トリクロロメチルインデン-4-イル、1-トリプロモメチルインデン-4-イル、1-フルオロメチルインデン-5-イル、1-クロロメチルインデン-5-イル、1-ブロモメチルインデン-5-イル、1-(2-フルオ
20 ロエチル) インデン-5-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-5-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-5-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-5-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-5-イル、1-(1-ブロモエチル) インデン-5-イル、1-トリフルオロメチルインデン-5-イル、1-トリクロロメチルインデン-5-イル、1-トリプロモメチルインデ
25 -5-イル、1-フルオロメチルインデン-6-イル、1-クロロメチルインデン-6-イル、1-ブロモメチルインデン-6-イル、1-(2-フルオロエチル) インデン-6-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-6-イル、1-(2-ブロモエチル) インデン-6-イル、1-(1-フルオロエチル) インデ
ン-6-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-6-イル、1-(1-プロ

モエチル) インデン-6-イル、1-トリフルオロメチルインデン-6-イル、
1-トリクロロメチルインデン-6-イル、1-トリブロモメチルインデン-6
-イル、1-フルオロメチルインデン-7-イル、1-クロロメチルインデン-
7-イル、1-ブロモメチルインデン-7-イル、1-(2-フルオロエチル)
5 インデン-7-イル、1-(2-クロロエチル) インデン-7-イル、1-(2-
-ブロモエチル) インデン-7-イル、1-(1-フルオロエチル) インデン-
7-イル、1-(1-クロロエチル) インデン-7-イル、1-(1-ブロモエ
チル) インデン-7-イル、1-トリフルオロメチルインデン-7-イル、1-
トリクロロメチルインデン-7-イル、1-トリブロモメチルインデン-7-イ
10 ル等が挙げられ、これらに限定されない。

上記の「ハロゲン化低級アルケニル基」としては、例えば3-フルオロ-1-
プロペニル、3-クロロ-1-プロペニル、3-ブロモ-1-プロペニル、4-
フルオロ-2-ブテニル、4-クロロ-2-ブテニル、4-ブロモ-2-ブテニ
ル、1-フルオロ-2-ブテニル、1-クロロ-2-ブテニル、1-ブロモ-2
15 -ブテニル等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルケニル基が挙げられ
る。

よって、上記のハロゲン化低級アルケニル基で置換されたアリール基としては、
例えば3-ハロ-1-プロペニルで置換されたアリール基(例、3-フルオロ-
1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-フルオロ-1-プロペニルで置換
20 されたナフタレン-1-イル、3-クロロ-1-プロペニルで置換されたフェニ
ル基、3-クロロ-1-プロペニルで置換されたナフタレン-1-イル、3-ブ
ロモ-1-プロペニルで置換されたフェニル基、3-ブロモ-1-プロペニルで
置換されたナフタレン-1-イル等)、4-ハロ-2-ブテニルで置換されたア
リール基(例、4-フルオロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-フル
25 オロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、4-クロロ-2-ブテ
ニルで置換されたフェニル基、4-クロロ-2-ブテニルで置換されたナフタレ
ン-1-イル、4-ブロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、4-ブロモ
-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等)、1-ハロ-2-ブテニ
ルで置換されたアリール基(例、1-フルオロ-2-ブテニルで置換されたフェ

ニル基、1-フルオロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-クロロ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-クロロ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたフェニル基、1-ブロモ-2-ブテニルで置換されたナフタレン-1-イル等)等が挙げられる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、ナフタレン-1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-があり特に限定されない。インデニルであれば、例えば、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-2-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-2-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-3-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-3-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-3-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-3-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-4-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル)インデン-4-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル)インデン-5-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル)インデン-

5-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル) インデン-5-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル) インデン-6-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル) インデン-6-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル) インデン-6-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル) インデン-6-イル、1-(3-フルオロ-1-プロペニル) インデン-7-イル、1-(3-クロロ-1-プロペニル) インデン-7-イル、1-(3-ブロモ-1-プロペニル) インデン-7-イル、1-(4-フルオロ-2-ブテニル) インデン-7-イル、1-(4-クロロ-2-ブテニル) インデン-7-イル、1-(4-ブロモ-2-ブテニル) インデン-7-イル、1-(1-フルオロ-2-ブテニル) インデン-7-イル、1-(1-クロロ-2-ブテニル) インデン-7-イル、1-(1-ブロモ-2-ブテニル) インデン-7-イル等が挙げられるが、これらに限定されない。

20 上記の「ハロゲン化低級アルコキシ基」としては、例えばフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、1-フルオロエトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ等の、ハロゲンで置換された前記定義の低級アルコキシ基等が挙げられる。

25 よって、上記のハロゲン化低級アルコキシ基で置換されたアリール基としては、例えばハロメトキシで置換されたアリール基（例、フルオロメトキシで置換されたフェニル基、フルオロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、クロロメトキシで置換されたフェニル基、クロロメトキシで置換されたナフタレン-1-イル、ブロモメトキシで置換されたフェニル基、ブロモメトキシで置換されたナ

フタレンー1-イル等)、ハロエトキシで置換されたアリール基(例、1-フル
オロエトキシで置換されたフェニル基、1-フルオロエトキシで置換されたナフ
タレンー1-イル、1-クロロエトキシで置換されたフェニル基、1-クロロエ
トキシで置換されたナフタレンー1-イル、1-ブロモエトキシで置換されたフェ
5 ニル基、1-ブロモエトキシで置換されたナフタレンー1-イル、2-フルオ
ロエトキシで置換されたフェニル基、2-フルオロエトキシで置換されたナフタ
レンー1-イル、2-クロロエトキシで置換されたフェニル基、2-クロロエト
キシで置換されたナフタレンー1-イル、2-ブロモエトキシで置換されたフェ
ニル基、2-ブロモエトキシで置換されたナフタレンー1-イル等)等が挙げら
10 れる。それぞれの置換位置としては、フェニル基であれば、2-、3-、4-が、
ナフタレンー1-イルであれば、2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-が
あり特に限定されない。インデニルであれば、例えば、1-フルオロメトキシイ
ンデンー2-イル、1-クロロメトキシインデンー2-イル、1-ブロモメトキ
シインデンー2-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデンー2-イル、1-
15 -(1-クロロエトキシ)インデンー2-イル、1-(1-ブロモエトキシ)イ
ンデンー2-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデンー2-イル、1-
(2-クロロエトキシ)インデンー2-イル、1-(2-ブロモエトキシ)イ
ンデンー2-イル、1-フルオロメトキシインデンー3-イル、1-クロロメトキ
シインデンー3-イル、1-ブロモメトキシインデンー3-イル、1-(1-フ
20 ルオロエトキシ)インデンー3-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデンー
3-イル、1-(1-ブロモエトキシ)インデンー3-イル、1-(2-フルオ
ロエトキシ)インデンー3-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデンー3-
イル、1-(2-ブロモエトキシ)インデンー3-イル、1-フルオロメトキシ
インデンー4-イル、1-クロロメトキシインデンー4-イル、1-ブロモメ
25 キシインデンー4-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデンー4-イル、
1-(1-クロロエトキシ)インデンー4-イル、1-(1-ブロモエトキシ)
インデンー4-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデンー4-イル、1-
(2-クロロエトキシ)インデンー4-イル、1-(2-ブロモエトキシ)イ
ンデンー4-イル、1-フルオロメトキシインデンー5-イル、1-クロロメトキ

シインデン-5-イル、1-ブロモメトキシインデン-5-イル、1-(1-フル
ルオロエトキシ)インデン-5-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-
5-イル、1-(1-プロモエトキシ)インデン-5-イル、1-(2-フルオ
ロエトキシ)インデン-5-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-5-
イル、1-(2-プロモエトキシ)インデン-5-イル、1-フルオロメトキシ
5 インデン-6-イル、1-クロロメトキシインデン-6-イル、1-ブロモメト
キシインデン-6-イル、1-(1-フルオロエトキシ)インデン-6-イル、
1-(1-クロロエトキシ)インデン-6-イル、1-(1-プロモエトキシ)
インデン-6-イル、1-(2-フルオロエトキシ)インデン-6-イル、1-
10 (2-クロロエトキシ)インデン-6-イル、1-(2-プロモエトキシ)イン
デン-6-イル、1-フルオロメトキシインデン-7-イル、1-クロロメトキ
シインデン-7-イル、1-ブロモメトキシインデン-7-イル、1-(1-フル
ルオロエトキシ)インデン-7-イル、1-(1-クロロエトキシ)インデン-
7-イル、1-(1-プロモエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-フルオ
15 ロエトキシ)インデン-7-イル、1-(2-クロロエトキシ)インデン-7-
イル、1-(2-プロモエトキシ)インデン-7-イル等が挙げられるが、これ
らに限定されない。

上記のヒドロキシ基で置換されたアリール基としては、例えば2-ヒドロキシ
フェニル、2-ヒドロキシナフタレン-1-イル、3-ヒドロキシフェニル、3-
20 -ヒドロキシナフタレン-1-イル、4-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシ
ナフタレン-1-イル、5-ヒドロキシナフタレン-1-イル、6-ヒドロキシ
ナフタレン-1-イル、7-ヒドロキシナフタレン-1-イル、8-ヒドロキシ
ナフタレン-1-イル、1-ヒドロキシインデン-1-イル、1-ヒドロキシイ
ンデン-2-イル、1-ヒドロキシインデン-3-イル、1-ヒドロキシインデ
ン-4-イル、1-ヒドロキシインデン-5-イル、1-ヒドロキシインデン-
25 6-イル、1-ヒドロキシインデン-7-イル、1, 4-ジヒドロキシインデン
-1-イル、1, 5-ジヒドロキシインデン-2-イル、2, 5-ジヒドロキシ
インデン-3-イル、1, 3-ジヒドロキシインデン-4-イル、1, 3-ジヒ
ドロキシインデン-5-イル、2, 4-ジヒドロキシインデン-6-イル、1,

4-ジヒドロキシインデン-7-イル等が挙げられる。

上記の「アシル基」とは、後述する「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシル基」と同意義である。

上記のアシル基で置換されたアリール基としては、例えば2-アセチルフェニル、2-アセチルナフタレン-1-イル、3-アセチルフェニル、3-アセチルナフタレン-1-イル、4-アセチルフェニル、4-アセチルナフタレン-1-イル、5-アセチルナフタレン-1-イル、6-アセチルナフタレン-1-イル、7-アセチルナフタレン-1-イル、8-アセチルナフタレン-1-イル、1-アセチルインデン-1-イル、1-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、1-アセチルインデン-5-イル、1-アセチルインデン-6-イル、1-アセチルインデン-7-イル、1-アセチルインデン-2-イル、3-アセチルインデン-2-イル、4-アセチルインデン-2-イル、5-アセチルインデン-2-イル、6-アセチルインデン-2-イル、7-アセチルインデン-2-イル、1-アセチルインデン-3-イル、2-アセチルインデン-3-イル、4-アセチルインデン-3-イル、5-アセチルインデン-3-イル、6-アセチルインデン-3-イル、7-アセチルインデン-3-イル、1-アセチルインデン-4-イル、2-アセチルインデン-4-イル、3-アセチルインデン-4-イル、5-アセチルインデン-4-イル、6-アセチルインデン-4-イル、7-アセチルインデン-4-イル、等が挙げられるが、これらに限定されない。

上記のアミノ基で置換されたアリール基としては、例えば2-アミノフェニル、2-アミノナフタレン-1-イル、3-アミノフェニル、3-アミノナフタレン-1-イル、4-アミノフェニル、4-アミノナフタレン-1-イル、5-アミノナフタレン-1-イル、6-アミノナフタレン-1-イル、7-アミノナフタレン-1-イル、8-アミノナフタレン-1-イル等が挙げられる。

G¹中のAは、好ましくは酸素原子である。

G¹中のR¹～R⁶で示される「ハロゲン原子」は、前記と同意義である。

G¹中のR¹～R⁶で示される「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の脂肪族炭化水素基とは、直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基（アルキル基、ア

ルケニル基、アルキニル基等)を意味する。

上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキル基の例としては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-エチルプロピル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、オクチル、デシル、テトラヒドロ
5 グラニル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ヘキサデシル、オクタデシル、ノナデシル、エイコサニル等の直鎖状または分枝状の炭素数1ないし20のアルキル基等が挙げられる。より好ましくは、炭素数1ないし10のアルキル基である。

10 上記の「脂肪族炭化水素基」のアルケニル基の例としては、例えばビニル、アリル、イソプロペニル、1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペン
15 テニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-ヘプテニル、1-オクテニル、グラニル、1-デセニル、1-テトラデセニル、1-オクタデセニル、9-オクタデセニル、1-エイコセニル、3, 7, 11, 15-テトラメチル-1-ヘキサデセニル等の直鎖状または分枝状の炭素数2ないし20のアルケニル基等
20 が挙げられる。より好ましくは、炭素数2ないし8のアルケニル基である。

20 上記の「脂肪族炭化水素基」のアルキニル基の例としては、例えばエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、2-ペンテン-4-イニル等の炭素数2ないし20の二重結合を有していてもよいアルキニル基等が挙げられる。より好ましくは、炭素数2ないし8のアルキニル基である。

25 G^1 中の $R^1 \sim R^6$ で示される「(置換されていてもよい脂肪族炭化水素基)-O-」とは酸素原子に前記定義した脂肪族炭化水素基が結合している基を意味し、例えばアルキルオキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基等を意味する。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の好ましい具体例としては、例えばハロゲン原子、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオ

- キシ、低級アルキルカルボニルオキシ、カルボキシ基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基、置換または非置換の複素環基、アシル基等が挙げられる。「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の数は1個～5個、好ましくは1個～3個である。置換基の位置は特に限定されない。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「ハロゲン」とは、前記と同意義である。

- 10 「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルコキシ基」は、前記と同意義である。

- 「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルケニルオキシ」としては、例えばビニルオキシ、アリルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-メチル-1-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-エチル-1-ブテニルオキシ、3-メチル-2-ブテニルオキシ、1-ペンテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ、3-ペンテニルオキシ、4-ペンテニルオキシ、4-メチル-3-ペンテニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルケニルオキシが挙げられる。

- 20 「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルカルボニルオキシ」としては、例えばメチルカルボニルオキシ、エチルカルボニルオキシ、プロピルカルボニルオキシ、イソプロピルカルボニルオキシ、ブチルカルボニルオキシ、イソブチルカルボニルオキシ、t-ブチルカルボニルオキシ、ペンチルカルボニルオキシ、イソペンチルカルボニルオキシ、ネオペンチルカルボニルオキシ、t-ペンチルカルボニルオキシ、ヘキシルカルボニルオキシ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルオキシが挙げられる。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換カルバモイル基」としては、例えばN-モノ低級アルキルカルバモイル基、N, N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-低級アルコキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-低

級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基等が挙げられる。

上記の「N-モノ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N-プロピルカルバモイル、N-イソプロピルカルバモイル、N-ペンチルカルバモイル、N-イソペンチルカルバモイル、N-ネオペンチルカルバモイル、N-t-ペンチルカルバモイル、N-1-エチルプロピルカルバモイル、N-ヘキシルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N, N-ジ低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN, N-ジメチルカルバモイル、N-エチル-N-メチルカルバモイル、N, N-ジエチルカルバモイル、N-メチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-メチルカルバモイル、N-ブチル-N-エチルカルバモイル、N-ブチル-N-プロピルカルバモイル、N-ブチル-N-イソプロピルカルバモイル、N, N-ジブチルカルバモイル、N-エチル-N-プロピルカルバモイル、N, N-ジプロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-n-プロピルカルバモイル、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばN-ヒドロキシ-N-メチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-エチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-プロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソプロピルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-sec-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-イソペンチルカルバモイル、N-ヒドロキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等の炭素数2ないし7のN-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基が挙げられる。

上記の「N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は3ないし13で

あるN-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、例えばN-メトキシ-N-メチルカルバモイル、N-メトキシ-N-エチルカルバモイル、N-メトキシ-N-プロピルカルバモイル、N-メトキシ-N-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソプロピルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-sec-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-t-ブチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-イソペンチルカルバモイル、N-メトキシ-N-ネオペンチルカルバモイル等が挙げられる。

上記の「N-置換フェニルカルバモイル基」の置換基としては、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシ基等が挙げられ、それらの意味は前記定義と同様である。「N-置換フェニルカルバモイル基」の好ましい具体例としては、例えば(4-メチルフェニル)カルバモイル、(4-エチルフェニル)カルバモイル、(4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4, 6-トリヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジメトキシ-6-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(4, 6-ジヒドロキシ-2-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジメトキシ-4-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジメトキシ-3-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 3-ジヒドロキシ-4-メトキシフェニル)カルバモイル、(3, 4-ジメトキシ-2-ヒドロキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジヒドロキシ-3-メトキシフェニル)カルバモイル、(2, 4-ジメトキシ-6-メチルフェニル)カルバモイル、(2, 6-ジメトキシ-4-メチルフェニル)カルバモイル等が挙げられる。

$R^1 \sim R^6$ の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換アミノ基」としては、例えばモノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基等が挙げられる。

5 上記の「モノ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、イソブチルアミノ、sec-ブチルアミノ、t-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、イソペンチルアミノ、ヘキシルアミノ等の炭素数1ないし6のモノ低級アルキルアミノ基が挙げられる。

10 上記の「ジ低級アルキルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、その全体の炭素数は2ないし20であるジ低級アルキルアミノ基、例えばジメチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルプロピルアミノ、エチルプロピルアミノ、イソプロピルメチルアミノ、イソプロピルエチルアミノ、ブチルメチルアミノ、ブチルエチルアミノ、イソブチルメチルアミノ、イソブチルエチルアミノ等が挙げられる。

15 上記の「低級アルキルカルボニルアミノ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、プロピルカルボニルアミノ、イソプロピルカルボニルアミノ、ブチルカルボニルアミノ、イソブチルカルボニルアミノ、sec-ブチルカルボニルアミノ、t-ブチルカルボニルアミノ、ペンチルカルボニルアミノ、イソペンチルカルボニルアミノ等の炭素数2ないし7のアルキルカルボニルアミノ基が挙げられる。

20 「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「低級アルキルチオ基」としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、ネオブチルチオ、t-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ等の炭素数1ないし6の低級アルキルチオ基が挙げられる。

25 「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」としては、例えばシクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等が挙げられ、その意味するところは、前記Ar¹およびAr²で示される「置換されていてもよい環式基」

における相当する意味と同様である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の単環式または縮合多環式アリール基」の意味するところは、前記Ar¹およびAr²で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「置換または非置換の複素環基」の複素環基の意味するところは、前記Ar¹およびAr²で示される「置換されていてもよい環式基」における相当する意味と同様である。

上記の「置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基の好ましい例としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。置換基があるとすれば、その数は1個～3個、好ましくは1個である。置換基の位置は特に限定されない。

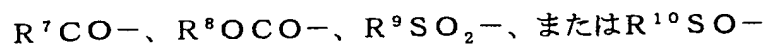
上記の「低級アルキルカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルキルは前記定義と同一であり、例えばアセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル等の炭素数2ないし6のアルカノイル基が挙げられる。

上記の「低級アルコキシカルボニル基」の好ましい例としては、その低級アルコキシは前記定義と同一であり、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル

ル、*n*-プロポキシカルボニル、*n*-ブトキシカルボニル等の炭素数2ないし7のアルコキシカルボニル基が挙げられる。

それ以外の置換基の意味するところは、「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基の用語として述べた通りである。

- 5 $R^1 \sim R^6$ の定義中および「置換されていてもよい脂肪族炭化水素基」の置換基としての「アシル基」とは、置換されていてもよいカルボン酸、置換されていてもよいオキシカルボン酸、置換されていてもよいスルホン酸、置換されていてもよいスルフィン酸等から由来するアシル基等が挙げられる。具体的には、式：



- 10 [式中、 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{10} はそれぞれ置換されていてもよい炭化水素基または複素環基を示す]

で表わされる基等が挙げられる。

- 上記 R^7 、 R^8 、 R^9 および R^{10} で示される「置換されていてもよい炭化水素基または複素環基」における「炭化水素基」としては、例えば、非環式基としては
15 直鎖状または分枝状の脂肪族炭化水素基（アルキル基、アルケニル基、アルキニル基等）等が挙げられ、環式基としては飽和または不飽和の脂環式炭化水素基（シクロアルキル基、シクロアルケニル基、シクロアルカジエニル基等）、単環式または縮合多環式アリール基等が挙げられる。これらの意味するところと置換基の具体例は、前述した通りである。

- 20 G^1 中の $R^1 \sim R^6$ で示される「置換されていてもよいアミノ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、*N*-低級
25 アルキルカルバモイル基、*N*-ヒドロキシカルバモイル基、*N*-ヒドロキシ-*N*-低級アルキルカルバモイル基、*N*-フェニルカルバモイル基、*N*-置換フェニルカルバモイル基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところ

は、前述した通りである。

G¹中のR¹～R⁶で示される「置換されていてもよいスルホ基」の置換基としては、例えばヒドロキシ基、低級アルキル基、置換基（ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシまたは低級アルキルカルボニル基）で置換された低級アルキル基、
5 低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル
10 基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、ニトロ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

15 G¹中のR¹～R⁶で示される「置換されていてもよいアリール基」のアリール基の意味するところは、前述した通りである。

G¹中のR¹～R⁶で示される「置換されていてもよいアリール基」の置換基としては、前記「置換の飽和または不飽和の脂環式炭化水素基」、「置換の単環式または縮合多環式アリール基」、「置換の複素環基」の置換基と同様なものが挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。
20

G¹中のR¹およびR²、R³およびR⁴またはR⁵およびR⁶が一緒になって形成される「置換されていてもよいメチレン基」の置換基としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシル基、置換または非置換のカルバモイル基、シアノ基、置換または非置換のアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。
25

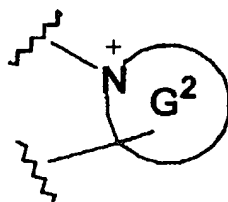
G¹中のR¹およびR²、R³およびR⁴またはR⁵およびR⁶が一緒になって形成される「置換されていてもよいイミノ基」の置換基としては、例えばハロゲン、

ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、置換または非置換のカルバモイル基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、アシル基等が挙げられる。それぞれの置換基の意味するところは、前述した通りである。

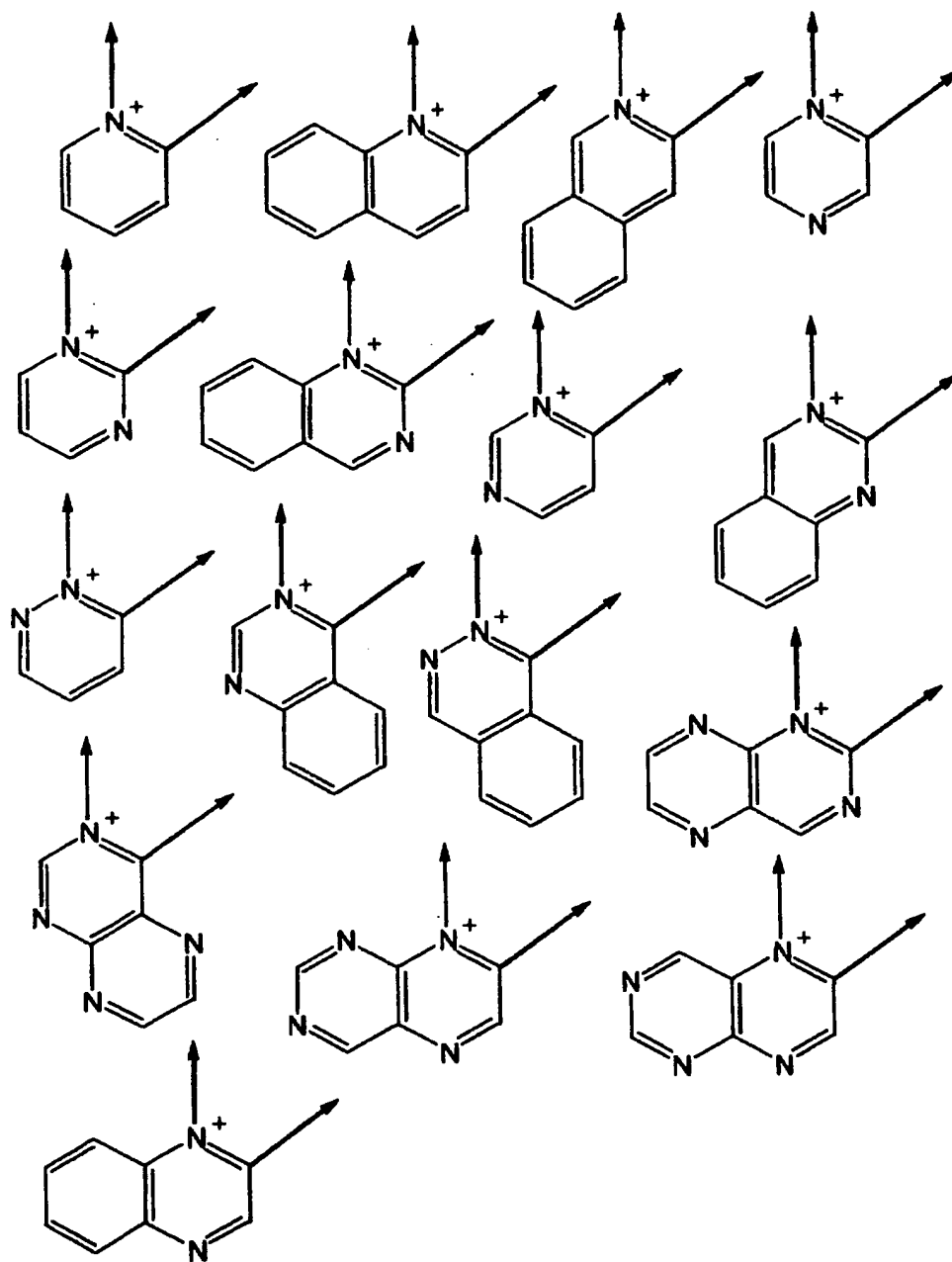
- 5 G^1 中の $R^1 \sim R^6$ は、好ましくはそれぞれ同一または異なって水素原子または低級アルキル基である。

G^1 は好ましくは、 $-O-$ または $-O-CR^1R^2-$ である。

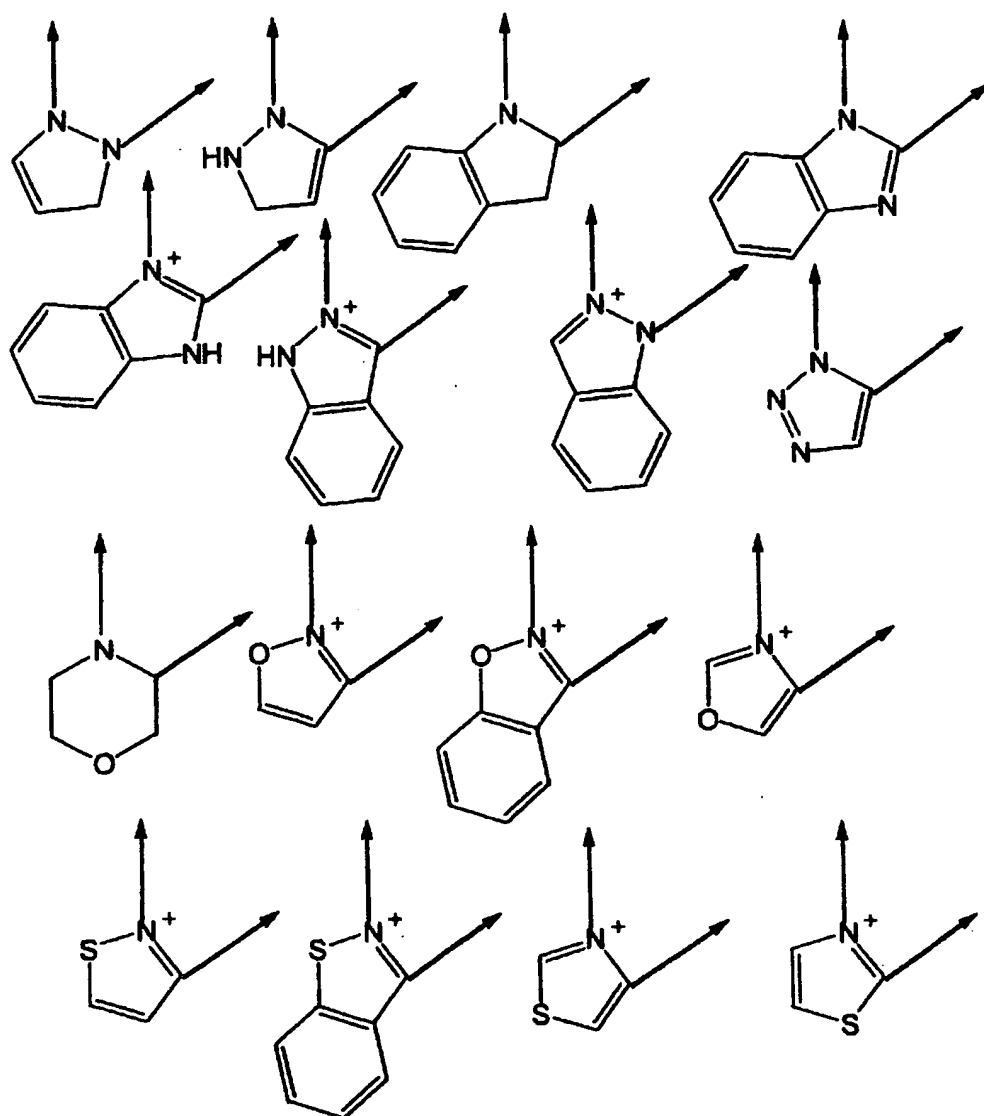
式：

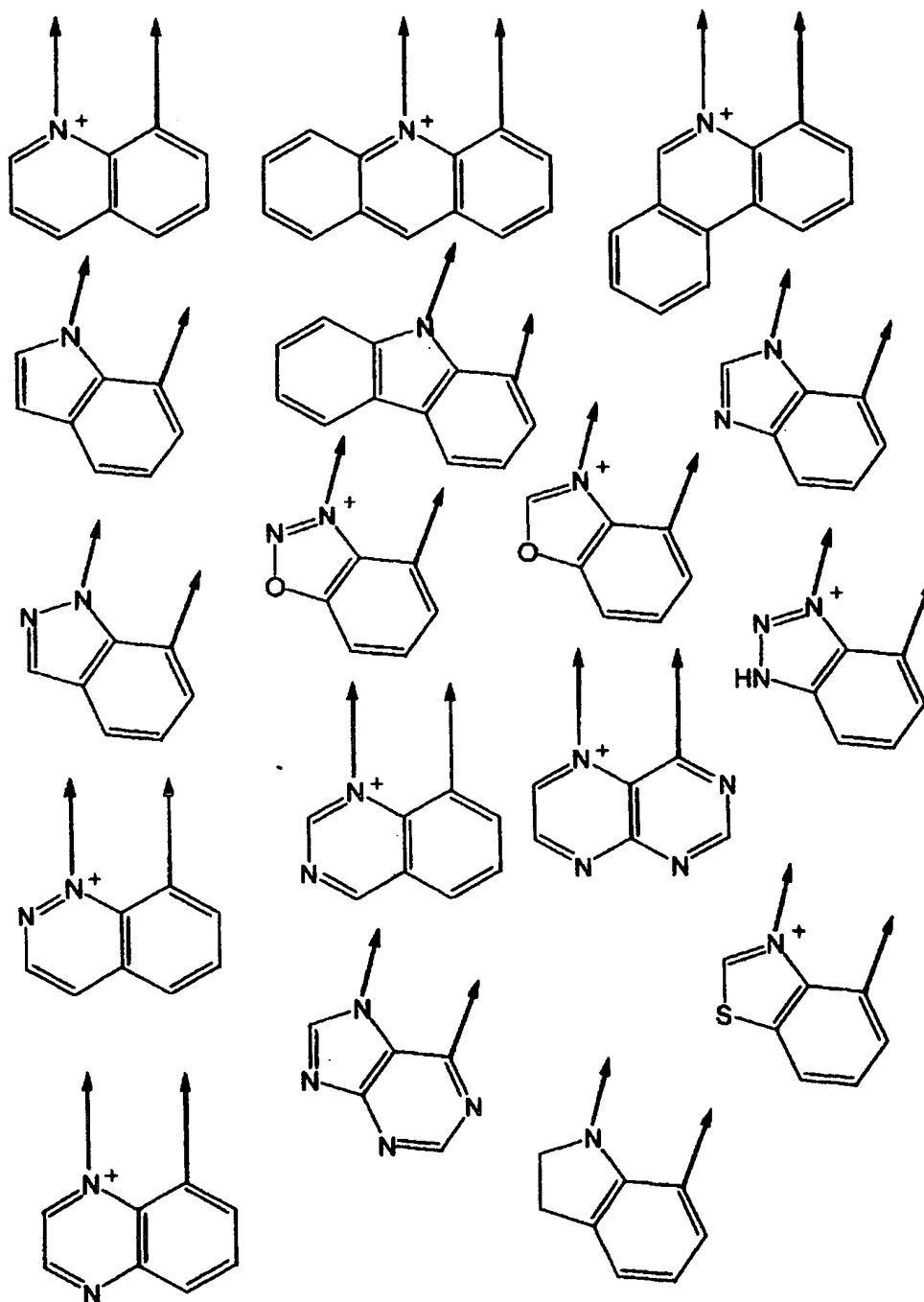


- 10 で示される、「置換されていてもよいアザ環式基（以下、該基を「 G^2 」と便宜的に略す）」は単環または縮合環のいずれであってもよい。例えば、以下の環式基が挙げられる。なお、以下の式中、ホウ素と結合している環内窒素原子にプラスを付していないものであっても、その窒素原子は水素または置換されていてもよい脂肪族炭化水素基（好ましくは、低級アルキル基（例、メチル等））で置換
- 15 されてプラスイオンを帯びているものとする。

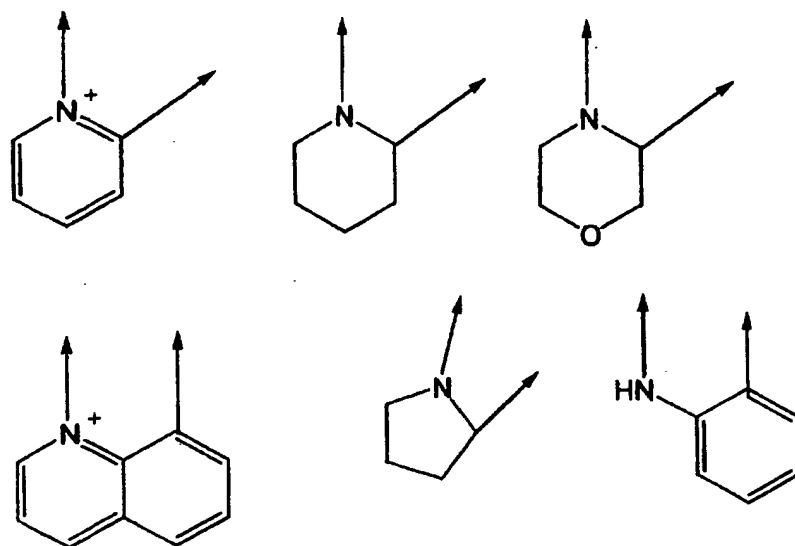


35





上記環式基のさらに好ましい例としては、以下の環式基が挙げられる。



一般式 (I) の定義中、「ただし、 B^- 、 G^1 および G^2 から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする」とは式 (I) 中、 B^- 、鎖式基である G^1 および基： G^2 中におけるホウ素と結合している窒素原子を含む環のうち最小の員数の環が5員または6員であることを意味している。

一般式 (I) 中、 Ar^1 および Ar^2 が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物が好ましく、より好ましくは一般式 (I) 中、 Ar^1 および Ar^2 がともに置換されていてもよいアリール基であり、 G^1 が式：
 $O-$ 、 $-O-CR^1R^2-$ または $-O-CR^3R^4-CR^5R^6-$ で表される基（式中、 $R^1 \sim R^6$ はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基）である化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物である。

式 (II) 中、 Ar^{*1} で示される置換されていてもよいアリール基は前記の定義と同義である。ただし、ここでは1位がナフタレン-1-イルで置換されているナフタレン-2-イルを除く。

Ar^{*2} で示される置換されていてもよい縮合アリール基（ただし、該縮合アリール基がナフタレン-2-イルである場合は、その1位がナフタレン-1-イル

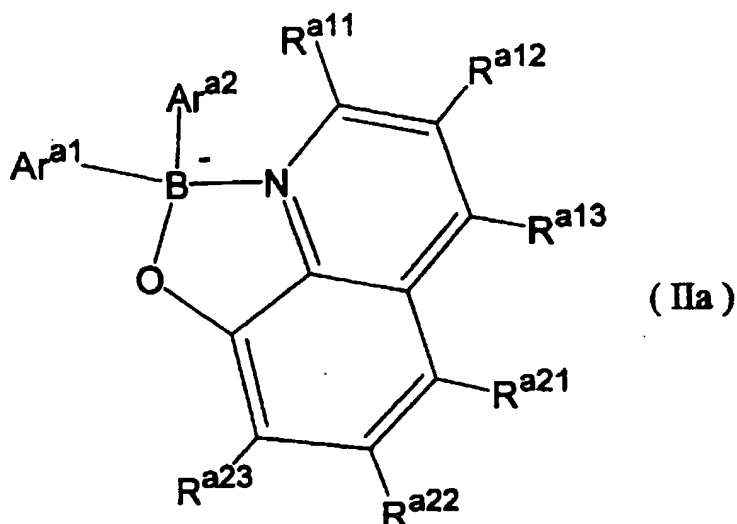
5 ルで置換されている場合を除く) としては、インデニル (1-インデニル、2-インデニル、3-インデニル、4-インデニル、5-インデニル、6-インデニル、7-インデニル)、ナフチル (1-ナフチル、2-ナフチル等)、アントリル、フェナントリル、アセナフチレニル、フルオレニル (9-フルオレニル、1-フルオレニル等) 等が挙げられる。

置換されていてもよい縮合アリール基の置換基の具体例としては、例えばハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルキル、置換基 (ハロゲン、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基または低級アルキルカルボニル基) で置換された低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルキルカルボニルオキシ基、カルボキシ基、低級アルキルカルボニル基、低級アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、N-ジ低級アルキルカルバモイル基、N-ヒドロキシカルバモイル基、N-ヒドロキシ-N-低級アルキルカルバモイル基、N-フェニルカルバモイル基、N-置換フェニルカルバモイル基、シアノ基、アミノ基、モノ低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルキルカルボニルアミノ基、アミジノ基、アジド基、ニトロ基、ニトロソ基、メルカプト基、低級アルキルチオ基、スルホ基、飽和または不飽和の脂環式炭化水素基、単環式または縮合多環式アリール基、複素環基等が挙げられる。置換基があるとすれば、その数は1個~3個、好ましくは1個である。置換基の位置は特に限定されない。

20 上記のうち、より好ましい置換基としては、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である。さらに好ましくは、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である。

R^{*1} および R^{*2} 中の各定義は前記の定義に従う。

25 式 (I I) で示される化合物中、好ましくは、一般式 (I I a) :



[式中、 Ar^{a1} および Ar^{a2} はともに置換されていてもよいアリールであり、

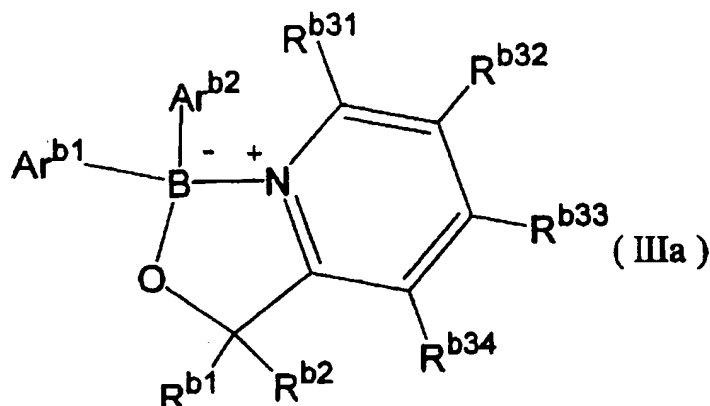
$R^{a11} \sim R^{a13}$ および $R^{a21} \sim R^{a23}$ はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]

で示される化合物である。より好ましくは、 $R^{a11} \sim R^{a13}$ および $R^{a21} \sim R^{a23}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物で

ある。さらに好ましくは、 R^{a11} 、 R^{a21} 、 R^{a23} がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

式(III)中、 Ar^{b1} 、 Ar^{b2} 、 R^{b1} 、 R^{b2} 、 R^{b3} における各定義は前記の定義に従う。

式(III)で示される化合物中、好ましくは、一般式(IIIa)：



[式中、 Ar^{b1} および Ar^{b2} はともに置換されていてもよいアリールであり、

R^{b1} および R^{b2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または
5 R^{b1} と R^{b2} が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

$R^{b31} \sim R^{b34}$ はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]

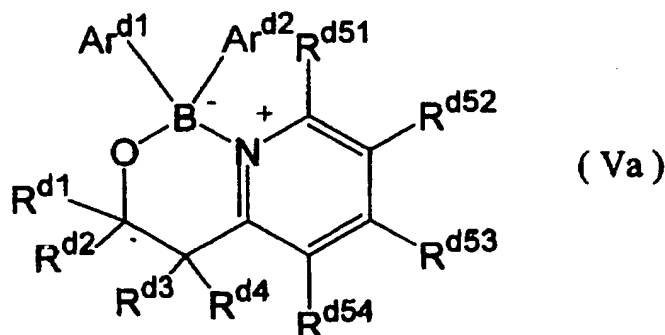
15 で示される化合物である。より好ましくは、 $R^{b31} \sim R^{b34}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。さらに好ましくは、 R^{b32} 、 R^{b33} 、 R^{b34} がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

20 式(IV)中、 Ar^{c1} 、 Ar^{c2} 、 R^{c1} 、 R^{c2} 、 R^{c3} における各定義は前記の定義に従う。

式 (I V) で示される化合物中、好ましくは Ar^{c1} および Ar^{c2} が置換されていてもよいアリールであり、 R^{c3} がそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す化合物である。さらに好ましくは、 R^{c3} がそれぞれ独立して、フッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

式 (V) 中、 Ar^{d1} 、 Ar^{d2} 、 R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} 、 R^{d4} 、 R^{d5} における各定義は前記の定義に従う。

式 (V) で示される化合物中、好ましくは一般式 (V a) :



[式中、 Ar^{d1} および Ar^{d2} は置換されていてもよいアリールであり、

R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} および R^{d4} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^{d1} と R^{d2} および/または R^{d3} と R^{d4} が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

$R^{d51} \sim R^{d54}$ はそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級ハロアルキル基、ヒドロキシ基、

置換されていてもよいアミノ基または置換されていてもよいスルホ基を示す]で示される化合物である。より好ましくは、 $R^{d51} \sim R^{d54}$ がそれぞれ独立して同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、メチル、トリハロメチル、ヒドロキシ基、メトキシ、アミノ基またはスルホ基である化合物である。さらに好ましくは、 R^{d52} 、 R^{d53} 、 R^{d54} がそれぞれ独立して同一または異なってフッ素、塩素、臭素、メチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ヒドロキシ基、メトキシまたはスルホ基である化合物である。

本発明は上記化合物の製薬的に許容される塩およびその水和物も包含する。

本発明の目的化合物の「塩」としては、製薬的に許容される塩が好ましく、例えば無機塩基との塩、有機塩基との塩、無機酸との塩、有機酸との塩、塩基性または酸性アミノ酸塩などが挙げられる。無機塩基との塩としては、ナトリウム塩、カリウム塩などのアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、バリウム塩などのアルカリ土類金属塩、ならびにアルミニウム塩、アンモニウム塩などが挙げられる。有機塩基との塩としては、トリメチルアミン、トリエチルアミン、ピリジン、ピコリン、エタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、ジシクロヘキシルアミン、N, N'-ジベンジルエチレンジアミンなどとの塩が挙げられる。無機酸との塩としては、塩酸、フッ化水素酸、臭化水素酸、硝酸、硫酸、リン酸、過塩素酸、ヨウ化水素酸などとの塩が挙げられる。有機酸との塩としては、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、シュウ酸、酒石酸、マレイン酸、クエン酸、コハク酸、リンゴ酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸などとの塩が挙げられる。塩基性アミノ酸との塩としては、アルギニン、リジン、オルニチンなどとの塩が挙げられ、酸性アミノ酸との塩としては、アスパラギン酸、グルタミン酸などとの塩が挙げられる。

本発明の目的化合物およびその塩の「水和物」は製薬的に許容される水和物が好ましく、具体的には、一水和物、二水和物、六水和物等が挙げられる。

本発明は別の態様として、上記式 (I)、(II)、(III)、(IV) または (V) で示される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物、抗原虫剤、抗コクシジウム剤に関する。

本明細書中、「動物（ヒトを除く）用医薬組成物」とはヒト以外の動物における疾病の診断、治療または予防に使用される薬剤を意味し、本発明の動物用医薬組成物としての用途は抗コクシジウム剤、成長促進剤等、すべての動物用医薬としての用途が包含される。本発明動物用医薬組成物の対象となる動物としては、
5 ニワトリ、ガチョウ、キジ、七面鳥、アヒル等の家禽類、ウシ、ウサギ、ヒツジ、ヤギ、ブタ等の家畜類が挙げられる。

抗原虫剤は、トキソプラズマ、マラリアおよび下記コクシジア等を包含する原虫類の感染を予防または治療するための薬剤を意味する。

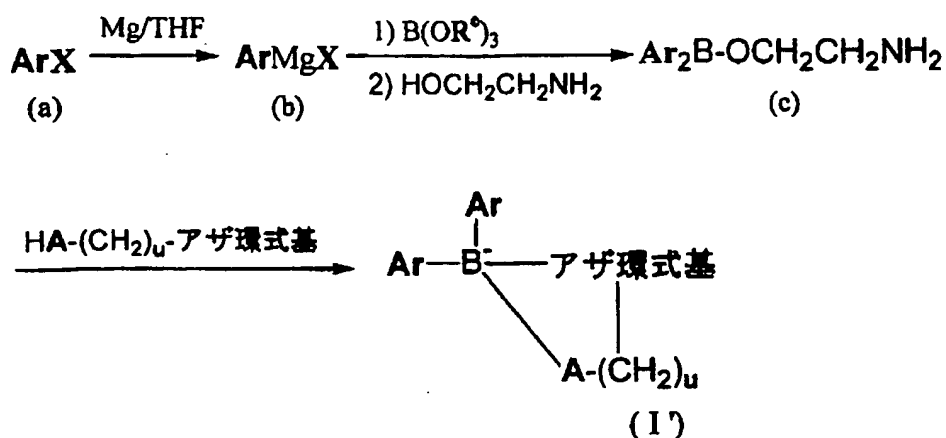
抗コクシジウム剤は、主なものとしてアイメリア・テネラ (*Eimeria*
10 *tenella*)、アイメリア・アセルブリーナ (*Eimeria acervulina*) およびアイメリア・ネカトリックス (*Eimeria necatrix*) 等による感染の予防および治療のための薬剤を意味する。

発明の実施の形態

本発明の化合物 (I) [すなわち、一般式 (I) で表される化合物。以下、他の式で表される化合物についても同様に略記することがある。]は、公知の文献
15 (例、*Youji Huaxue* (1989), 9(3), 226-9、*Pharmazie* (1985), 40(11), 767-71、*Pharmazie* (1985), 40(6), 387-93、*Pharmazie* (1985), 40(5), 307-11、*J. Chem. Soc. Perkin Train.* 2 (1992) 527-532、*Journal of Organometallic Chemistry*, 297(1985) 13-19) を参考にして、例えば以下に示す合成ルートによって製造することができる。
20

なお、これらのルートにおいて置換基の種類 (R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4) によっては以下の反応において反応性を有することがある (例、ヒドロキシ基、カルボニル基およびアミノ基等) が、その場合は適宜置換基に保護基を導入し反応後除去することにより製造を行えばよい。

25 (反応式)



[式中、uは0、1または2の整数、R[°]は炭素数1～8のアルキル基を示し、他の記号は前記と同意義である]

5 工程 1

まず、化合物 (a) とマグネシウムをテトラヒドロフラン (THF) などのエーテル溶媒中で反応させることにより、式: ArMgX (b) で示される化合物を製造する。本反応において、化合物 (a) は、マグネシウムに対して1当量またはそれ以上、好ましくは1.1～1.3当量使用することができる。使用できるエーテル系溶媒としてはテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサンなどが挙げられる。さらに必要なら芳香族炭化水素類 (例、トルエン、ベンゼン、キシレンなど)、または飽和炭化水素類 (例、シクロヘキサン、ヘキサンなど) をエーテル系溶媒との混合溶媒として使用することができる。反応温度は-20～150℃、好ましくは0～50℃である。反応時間は化合物により異なるが0.5～10時間反応させればよい。反応生成物は通常透明溶液またはスラリーとして得られる。

工程 2

上記得られた化合物 (b) を含む溶液またはスラリーにホウ酸化合物 (B(OR[°])₃) を反応させた後、さらにエタノールアミン (HOCH₂CH₂NH₂) を適当な溶媒中で反応させることにより式 (c) で示される化合物を製造する。

本反応において、上記工程 1 で得られた化合物 (b) に対してホウ酸エステル

は0.5当量またはそれ以下、好ましくは0.5～0.4当量使用することができる。逐次反応のエタノールアミンは化合物(b)に対して0.5当量またはそれ以上、好ましくは0.5～0.7当量使用することができる。本反応においては必要なら工程1に記載したエーテル類、芳香族炭化水素類、飽和炭化水素類の溶媒を使用することができる。化合物(b)とホウ酸エステルとの反応温度は-90～100℃、好ましくは-30～40℃、反応時間は化合物により異なるが0.5～10時間反応させればよい。また、逐次反応のエタノールアミンとの反応温度は0～100℃、好ましくは30～80℃、反応時間は通常0.5～5時間反応させればよい。化合物(c)は粗製物として、あるいは常法(例、カラムクロマトグラフィー、再結晶など)により精製して次工程に使用することができる。

工程3

化合物(c)に式： $\text{HA}-(\text{CH}_2)_n$ -アザ環式基
で表される化合物を適当な溶媒中で反応させることにより、式(I')で示される本発明化合物を製造することができる。 $\text{HA}-(\text{CH}_2)_n$ -アザ環式基で表される化合物は化合物(c)に対して1～2当量、好ましくは1～1.5当量使用することができる。使用できる溶媒としては、エーテル類(例、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンなど)、炭化水素類(例、ベンゼン、トルエン、キシレンなど)、アルコール類(例、メタノール、エタノール、n-プロパノールなど)、水およびそれらの混合溶媒などが挙げられる。反応温度は0～150℃、好ましくは20～120℃であり、反応時間は通常、0.5～10時間である。得られた所望の化合物(I')は要すれば、例えばカラムクロマトグラフィー、再結晶などにより精製することができる。

25

実施例

以下に参考例および実施例を挙げて本発明をさらに詳細に説明するが、これらは本発明の範囲の限定を意図するものでない。

参考例および実施例中、Phはフェニル基、Naphはナフチル基、Me₃S

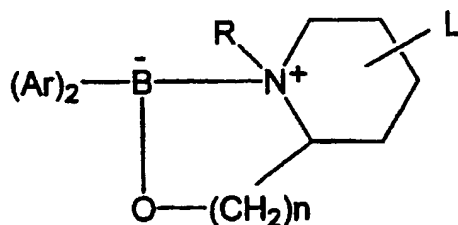
i-Ph はトリメチルシリルフェニル基、t-Bu はt-ブチル基、をそれぞれ意味する。

参考例 1

5 ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル ($\text{Ph}_2\text{B}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$) の合成

プロモベンゼン 83.2 g (0.53 mol)、マグネシウム 12.9 g (0.53 mol) およびテトラヒドロフラン 250 ml を用いて常法にてフェニルマグネシウムブロマイドのテトラヒドロフラン溶液を調製した。次いで、フラスコにホウ酸トリブチルエステル
 10 58.5 g (0.26 mol)、エチルエーテル 200 ml を仕込み、 -60°C に冷却維持しフェニルマグネシウムブロマイドのテトラヒドロフラン溶液 (グリニャール試薬) を滴下した。滴下終了後、室温下で 10 時間攪拌した後、10% 塩酸水溶液 150 ml を加えて加水分解し有機層を分液した。得られた有機層にエタノールアミン 31.1 g (0.51 mol)、エタノール 50 ml を加えて 2 時間室温下で攪拌した。生成した沈殿
 15 を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶のジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 31.9 g (収率 55%) を得た。

以下の実施例 1 ~ 4 は下記式で示される化合物に関する：



20 実施例 1

化合物 1 (式中、n が 1、Ar がフェニル、R および L が水素) の合成

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.6 g (0.012 mol)、エチルエーテル 30 ml および 10% 塩酸水溶液 30 ml をロートに仕込み、約 15 分間振り混ぜた後分液し、有機層を 1 回水洗しナスフラスコに移し替えた。その後、2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.1 g (0.018 mol) とエタノール 7 ml を加えて室温下で 2 時
 25

間攪拌した。生成した沈殿を濾集し、含水アルコールで再結晶し乾燥して白色結晶の化合物 1 を 2.8g (収率83%) 得た。

融点 : 169~171℃

5 実施例 2

化合物 2 (式中、n が 1、Ar が 2-メチルフェニル、R および L が水素) の合成

ジ (2-メチル) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.04 g (0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 2 を 2.18g (収率78%) 得た。

融点 : 126~128℃

実施例 3

化合物 9 の合成

15 ジ (3-クロロ) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル 3.54g (0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 9 を 3.28g (収率78%) 得た。

融点 : 155~159℃

20 実施例 4

化合物 31 (表中、n が 1、Ar が α -ナフチル、R および L が水素) の合成

ジ α -ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル 3.90 g (0.012mol) と 2-ヒドロキシメチルピペリジン 2.10g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 31 を 3.01g (収率79%) 得た。

25 融点 : 176~178℃

上記実施例 1~4 を参考にすれば、以下の表 1~6 中に示される化合物を製造することができる。

表 1

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---|---------|
| 1 | 1 | Ph | H | H | 169-171 |
| 2 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | H | H | 126-128 |
| 3 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | H | H | 203-205 |
| 4 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | H | H | 134-136 |
| 5 | 1 | 2-F-Ph | H | H | |
| 6 | 1 | 3-F-Ph | H | H | |
| 7 | 1 | 4-F-Ph | H | H | 134-136 |
| 8 | 1 | 2-Cl-Ph | H | H | |
| 9 | 1 | 3-Cl-Ph | H | H | 155-159 |
| 10 | 1 | 4-Cl-Ph | H | H | |
| 11 | 1 | 2-Br-Ph | H | H | |
| 12 | 1 | 3-Br-Ph | H | H | |
| 13 | 1 | 4-Br-Ph | H | H | |
| 14 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 15 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | H | H | 95-97 |
| 16 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 17 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | H | H | |
| 18 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | H | H | 148-151 |
| 19 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | H | H | |
| 20 | 1 | 4-tBu-Ph | H | H | |
| 21 | 1 | 2-OPh-Ph | H | H | |
| 22 | 1 | 3-OPh-Ph | H | H | |
| 23 | 1 | 4-OPh-Ph | H | H | |
| 24 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | H | |
| 25 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | H | |
| 26 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 27 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | H | |
| 28 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | H | |
| 29 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 30 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 31 | 1 | α -Naph | H | H | 176-178 |
| 32 | 1 | β -Naph | H | H | |
| 33 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | H | |

表 2

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---|---------|
| 34 | 2 | Ph | H | H | |
| 35 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | H | H | |
| 36 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | H | H | |
| 37 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | H | H | |
| 38 | 2 | 2-F-Ph | H | H | |
| 39 | 2 | 3-F-Ph | H | H | |
| 40 | 2 | 4-F-Ph | H | H | |
| 41 | 2 | 2-Cl-Ph | H | H | |
| 42 | 2 | 3-Cl-Ph | H | H | |
| 43 | 2 | 4-Cl-Ph | H | H | |
| 44 | 2 | 2-Br-Ph | H | H | |
| 45 | 2 | 3-Br-Ph | H | H | |
| 46 | 2 | 4-Br-Ph | H | H | |
| 47 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 48 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 49 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 50 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | H | H | |
| 51 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | H | H | |
| 52 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | H | H | |
| 53 | 2 | 4-tBu-Ph | H | H | |
| 54 | 2 | 2-OPh-Ph | H | H | |
| 55 | 2 | 3-OPh-Ph | H | H | |
| 56 | 2 | 4-OPh-Ph | H | H | |
| 57 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | H | |
| 58 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | H | |
| 59 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 60 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | H | |
| 61 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | H | |
| 62 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 63 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | H | |
| 64 | 2 | α -Naph | H | H | |
| 65 | 2 | β -Naph | H | H | |
| 66 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | H | |

表 3

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-----------------|---|---------|
| 67 | 1 | Ph | CH ₃ | H | |
| 68 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 69 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 70 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 71 | 1 | 2-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 72 | 1 | 3-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 73 | 1 | 4-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 74 | 1 | 2-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 75 | 1 | 3-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 76 | 1 | 4-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 77 | 1 | 2-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 78 | 1 | 3-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 79 | 1 | 4-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 80 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 81 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 82 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 83 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 84 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 85 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 86 | 1 | 4-tBu-Ph | CH ₃ | H | |
| 87 | 1 | 2-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 88 | 1 | 3-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 89 | 1 | 4-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 90 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | CH ₃ | H | |
| 91 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | CH ₃ | H | |
| 92 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 93 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 94 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 95 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 96 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 97 | 1 | α -Naph | CH ₃ | H | |
| 98 | 1 | β -Naph | CH ₃ | H | |
| 99 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | CH ₃ | H | |

表 4

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-----------------|---|---------|
| 100 | 2 | Ph | CH ₃ | H | |
| 101 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 102 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 103 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 104 | 2 | 2-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 105 | 2 | 3-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 106 | 2 | 4-F-Ph | CH ₃ | H | |
| 107 | 2 | 2-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 108 | 2 | 3-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 109 | 2 | 4-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 110 | 2 | 2-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 111 | 2 | 3-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 112 | 2 | 4-Br-Ph | CH ₃ | H | |
| 113 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 114 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 115 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 116 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 117 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 118 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 119 | 2 | 4-tBu-Ph | CH ₃ | H | |
| 120 | 2 | 2-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 121 | 2 | 3-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 122 | 2 | 4-OPh-Ph | CH ₃ | H | |
| 123 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | CH ₃ | H | |
| 124 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | CH ₃ | H | |
| 125 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 126 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 127 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | CH ₃ | H | |
| 128 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 129 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | CH ₃ | H | |
| 130 | 2 | α -Naph | CH ₃ | H | |
| 131 | 2 | β -Naph | CH ₃ | H | |
| 132 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | CH ₃ | H | |

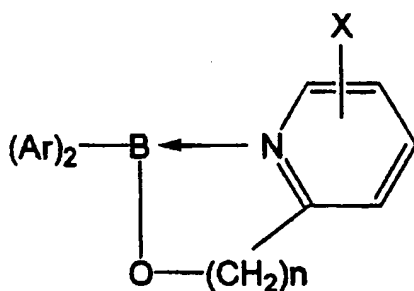
表 5

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|-------------------|---------|
| 133 | 1 | Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 134 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 135 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 136 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 137 | 1 | 2-F-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 138 | 1 | 3-F-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 139 | 1 | 4-F-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 140 | 1 | 2-Cl-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 141 | 1 | 3-Cl-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 142 | 1 | 4-Cl-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 143 | 1 | 2-Br-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 144 | 1 | 3-Br-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 145 | 1 | 4-Br-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 146 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 147 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 148 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 149 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 150 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 151 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 152 | 1 | 4-tBu-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 153 | 1 | 2-OPh-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 154 | 1 | 3-OPh-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 155 | 1 | 4-OPh-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 156 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 157 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 158 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 159 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 160 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 161 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 162 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | 6-CH ₃ | |
| 163 | 1 | α -Naph | H | 6-CH ₃ | |
| 164 | 1 | β -Naph | H | 6-CH ₃ | |
| 165 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | 6-CH ₃ | |

表 6

| 化合物 No. | n | Ar | R | L | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---------------------|---------|
| 166 | 1 | Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 167 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 168 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 169 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 170 | 1 | 2-F-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 171 | 1 | 3-F-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 172 | 1 | 4-F-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 173 | 1 | 2-Cl-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 174 | 1 | 3-Cl-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 175 | 1 | 4-Cl-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 176 | 1 | 2-Br-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 177 | 1 | 3-Br-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 178 | 1 | 4-Br-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 179 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 180 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 181 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 182 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 183 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 184 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 185 | 1 | 4-tBu-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 186 | 1 | 2-OPh-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 187 | 1 | 3-OPh-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 188 | 1 | 4-OPh-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 189 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 190 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 191 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 192 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 193 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 194 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 195 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 196 | 1 | α -Naph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 197 | 1 | β -Naph | H | 3,5-Me ₂ | |
| 198 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | 3,5-Me ₂ | |

以下の実施例 5 および 6 は下記式で示される化合物に関する：



実施例 5

化合物 199 (式中、n は 1、Ar はフェニル、X は水素) の合成

ジフェニルボロン酸エタノールアミンエステル 2.6 g (0.012mol) とエチルエー
 テル 30 ml および 10% 塩酸水溶液 30ml をロートに仕込み、約 15 分間振り混ぜた
 5 後分液し、有機層を 1 回水洗し有機層をナスフラスコに移し替えた。

2-ヒドロキシメチルピリジン 1.94g (0.018mol) およびエタノール 7ml を
 加えて室温下で 2 時間攪拌した。生成した沈殿を濾集し含水アルコールで再結晶
 し、乾燥して白色結晶の化合物 199 を 2.5g (収率 76%) 得た。

10 融点: 150~151°C

実施例 6

化合物 246 (n は 2、Ar は 3-トリフルオロメチル、X は水素) の合成

ジ (3-トリフルオロメチル) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル
 15 2.77 g (0.012mol) と 2-ヒドロキシエチルピリジン 2.21g (0.018mol) を化合物 1
 の合成法と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 246 を 3.96g (収率 78%) 得た。

融点: 140~142°C

上記実施例 5 および 6 を参考にすれば、以下の表 7~20 中に示される化合物
 20 を製造することができる。

表 7

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---------|
| 199 | 1 | Ph | H | 150-151 |
| 200 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | H | 188-192 |
| 201 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | H | 117-119 |
| 202 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | H | 147-149 |
| 203 | 1 | 2-F-Ph | H | |
| 204 | 1 | 3-F-Ph | H | |
| 205 | 1 | 4-F-Ph | H | 137-139 |
| 206 | 1 | 2-Cl-Ph | H | |
| 207 | 1 | 3-Cl-Ph | H | |
| 208 | 1 | 4-Cl-Ph | H | 133-134 |
| 209 | 1 | 2-Br-Ph | H | |
| 210 | 1 | 3-Br-Ph | H | |
| 211 | 1 | 4-Br-Ph | H | |
| 212 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | H | |
| 213 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | H | 92-94 |
| 214 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | H | |
| 215 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | H | 163-165 |
| 216 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | H | |
| 217 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | H | 129-131 |
| 218 | 1 | 2-OPh-Ph | H | |
| 219 | 1 | 3-OPh-Ph | H | |
| 220 | 1 | 4-OPh-Ph | H | |
| 221 | 1 | 4-tBu-Ph | H | |
| 222 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 223 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 224 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 225 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | |
| 226 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | |
| 227 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 228 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 229 | 1 | α -Naph | H | 233-236 |
| 230 | 1 | β -Naph | H | |
| 231 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | |

表 8

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---------|
| 232 | 2 | Ph | H | 176-178 |
| 233 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | H | 208-211 |
| 234 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | H | |
| 235 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | H | |
| 236 | 2 | 2-F-Ph | H | |
| 237 | 2 | 3-F-Ph | H | |
| 238 | 2 | 4-F-Ph | H | 118-120 |
| 239 | 2 | 2-Cl-Ph | H | |
| 240 | 2 | 3-Cl-Ph | H | |
| 241 | 2 | 4-Cl-Ph | H | 140-142 |
| 242 | 2 | 2-Br-Ph | H | |
| 243 | 2 | 3-Br-Ph | H | |
| 244 | 2 | 4-Br-Ph | H | |
| 245 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | H | |
| 246 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | H | 140-142 |
| 247 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | H | |
| 248 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | H | |
| 249 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | H | |
| 250 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | H | 131-133 |
| 251 | 2 | 4-tBu-Ph | H | |
| 252 | 2 | 2-OPh-Ph | H | |
| 253 | 2 | 3-OPh-Ph | H | |
| 254 | 2 | 4-OPh-Ph | H | |
| 255 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 256 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 257 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 258 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | |
| 259 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | |
| 260 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 261 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 262 | 2 | α -Naph | H | 215-218 |
| 263 | 2 | β -Naph | H | |
| 264 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | |

表 9

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 265 | 1 | Ph | 2-Cl | |
| 266 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 267 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 268 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 269 | 1 | 2-F-Ph | 2-Cl | |
| 270 | 1 | 3-F-Ph | 2-Cl | |
| 271 | 1 | 4-F-Ph | 2-Cl | |
| 272 | 1 | 2-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 273 | 1 | 3-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 274 | 1 | 4-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 275 | 1 | 2-Br-Ph | 2-Cl | |
| 276 | 1 | 3-Br-Ph | 2-Cl | |
| 277 | 1 | 4-Br-Ph | 2-Cl | |
| 278 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 279 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 280 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 281 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 282 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 283 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 284 | 1 | 4-tBu-Ph | 2-Cl | |
| 285 | 1 | 2-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 286 | 1 | 3-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 287 | 1 | 4-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 288 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2-Cl | |
| 289 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2-Cl | |
| 290 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 291 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 292 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 293 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 294 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 295 | 1 | α -Naph | 2-Cl | |
| 296 | 1 | β -Naph | 2-Cl | |
| 297 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2-Cl | |

表 10

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 298 | 2 | Ph | 2-Cl | |
| 299 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 300 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 301 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 302 | 2 | 2-F-Ph | 2-Cl | |
| 303 | 2 | 3-F-Ph | 2-Cl | |
| 304 | 2 | 4-F-Ph | 2-Cl | |
| 305 | 2 | 2-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 306 | 2 | 3-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 307 | 2 | 4-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 308 | 2 | 2-Br-Ph | 2-Cl | |
| 309 | 2 | 3-Br-Ph | 2-Cl | |
| 310 | 2 | 4-Br-Ph | 2-Cl | |
| 311 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 312 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 313 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 314 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 315 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 316 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 317 | 2 | 4-tBu-Ph | 2-Cl | |
| 318 | 2 | 2-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 319 | 2 | 3-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 320 | 2 | 4-OPh-Ph | 2-Cl | |
| 321 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2-Cl | |
| 322 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2-Cl | |
| 323 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 324 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 325 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2-Cl | |
| 326 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 327 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2-Cl | |
| 328 | 2 | α -Naph | 2-Cl | |
| 329 | 2 | β -Naph | 2-Cl | |
| 330 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2-Cl | |

表 1 1

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 331 | 1 | Ph | 3-Cl | |
| 332 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 333 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 334 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 335 | 1 | 2-F-Ph | 3-Cl | |
| 336 | 1 | 3-F-Ph | 3-Cl | |
| 337 | 1 | 4-F-Ph | 3-Cl | |
| 338 | 1 | 2-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 339 | 1 | 3-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 340 | 1 | 4-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 341 | 1 | 2-Br-Ph | 3-Cl | |
| 342 | 1 | 3-Br-Ph | 3-Cl | |
| 343 | 1 | 4-Br-Ph | 3-Cl | |
| 344 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 345 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 346 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 347 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 348 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 349 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 350 | 1 | 2-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 351 | 1 | 4-tBu-Ph | 3-Cl | |
| 352 | 1 | 3-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 353 | 1 | 4-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 354 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 3-Cl | |
| 355 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 3-Cl | |
| 356 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 357 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 358 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 359 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 360 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 361 | 1 | α -Naph | 3-Cl | |
| 362 | 1 | β -Naph | 3-Cl | |
| 363 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 3-Cl | |

表 1 2

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 364 | 2 | Ph | 3-Cl | |
| 365 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 366 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 367 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 368 | 2 | 2-F-Ph | 3-Cl | |
| 369 | 2 | 3-F-Ph | 3-Cl | |
| 370 | 2 | 4-F-Ph | 3-Cl | |
| 371 | 2 | 2-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 372 | 2 | 3-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 373 | 2 | 4-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 374 | 2 | 2-Br-Ph | 3-Cl | |
| 375 | 2 | 3-Br-Ph | 3-Cl | |
| 376 | 2 | 4-Br-Ph | 3-Cl | |
| 377 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 378 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 379 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 380 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 381 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 382 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 383 | 2 | 4-tBu-Ph | 3-Cl | |
| 384 | 2 | 2-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 385 | 2 | 3-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 386 | 2 | 4-OPh-Ph | 3-Cl | |
| 387 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 3-Cl | |
| 388 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 3-Cl | |
| 389 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 390 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 391 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 3-Cl | |
| 392 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 393 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 3-Cl | |
| 394 | 2 | α -Naph | 3-Cl | |
| 395 | 2 | β -Naph | 3-Cl | |
| 396 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 3-Cl | |

表 1 3

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 397 | 1 | Ph | 4-Cl | |
| 398 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 399 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 400 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 401 | 1 | 2-F-Ph | 4-Cl | |
| 402 | 1 | 3-F-Ph | 4-Cl | |
| 403 | 1 | 4-F-Ph | 4-Cl | |
| 404 | 1 | 2-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 405 | 1 | 3-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 406 | 1 | 4-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 407 | 1 | 2-Br-Ph | 4-Cl | |
| 408 | 1 | 3-Br-Ph | 4-Cl | |
| 409 | 1 | 4-Br-Ph | 4-Cl | |
| 410 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 411 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 412 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 413 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 414 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 415 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 416 | 1 | 4-tBu-Ph | 4-Cl | |
| 417 | 1 | 2-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 418 | 1 | 3-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 419 | 1 | 4-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 420 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl | |
| 421 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl | |
| 422 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 423 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 424 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 425 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 426 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 427 | 1 | α -Naph | 4-Cl | |
| 428 | 1 | β -Naph | 4-Cl | |
| 429 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 4-Cl | |

表 1 4

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 430 | 2 | Ph | 4-Cl | |
| 431 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 432 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 433 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 434 | 2 | 2-F-Ph | 4-Cl | |
| 435 | 2 | 3-F-Ph | 4-Cl | |
| 436 | 2 | 4-F-Ph | 4-Cl | |
| 437 | 2 | 2-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 438 | 2 | 3-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 439 | 2 | 4-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 440 | 2 | 2-Br-Ph | 4-Cl | |
| 441 | 2 | 3-Br-Ph | 4-Cl | |
| 442 | 2 | 4-Br-Ph | 4-Cl | |
| 443 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 444 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 445 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 446 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 447 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 448 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 449 | 2 | 4-tBu-Ph | 4-Cl | |
| 450 | 2 | 2-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 451 | 2 | 3-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 452 | 2 | 4-OPh-Ph | 4-Cl | |
| 453 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl | |
| 454 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 4-Cl | |
| 455 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 456 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 457 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 4-Cl | |
| 458 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 459 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 4-Cl | |
| 460 | 2 | α -Naph | 4-Cl | |
| 461 | 2 | β -Naph | 4-Cl | |
| 462 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 4-Cl | |

表 1 5

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 463 | 1 | Ph | 4-CF ₃ | |
| 464 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 465 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 466 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 467 | 1 | 2-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 468 | 1 | 3-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 469 | 1 | 4-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 470 | 1 | 2-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 471 | 1 | 3-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 472 | 1 | 4-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 473 | 1 | 2-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 474 | 1 | 3-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 475 | 1 | 4-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 476 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 477 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 478 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 479 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 480 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 481 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 482 | 1 | 4-tBu-Ph | 4-CF ₃ | |
| 483 | 1 | 2-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 484 | 1 | 3-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 485 | 1 | 4-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 486 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 487 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 488 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 489 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 490 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 491 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 492 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 493 | 1 | α -Naph | 4-CF ₃ | |
| 494 | 1 | β -Naph | 4-CF ₃ | |
| 495 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 4-CF ₃ | |

表 1 6

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 496 | 2 | Ph | 4-CF ₃ | |
| 497 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 498 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 499 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 500 | 2 | 2-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 501 | 2 | 3-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 502 | 2 | 4-F-Ph | 4-CF ₃ | |
| 503 | 2 | 2-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 504 | 2 | 3-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 505 | 2 | 4-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 506 | 2 | 2-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 507 | 2 | 3-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 508 | 2 | 4-Br-Ph | 4-CF ₃ | |
| 509 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 510 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 511 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 512 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 513 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 514 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 515 | 2 | 4-tBu-Ph | 4-CF ₃ | |
| 516 | 2 | 2-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 517 | 2 | 3-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 518 | 2 | 4-OPh-Ph | 4-CF ₃ | |
| 519 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 520 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 521 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 522 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 523 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 4-CF ₃ | |
| 524 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 525 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 4-CF ₃ | |
| 526 | 2 | α -Naph | 4-CF ₃ | |
| 527 | 2 | β -Naph | 4-CF ₃ | |
| 528 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 4-CF ₃ | |

表 1 7

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 529 | 1 | Ph | 5-CF ₃ | |
| 530 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 531 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 532 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 533 | 1 | 2-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 534 | 1 | 3-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 535 | 1 | 4-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 536 | 1 | 2-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 537 | 1 | 3-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 538 | 1 | 4-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 539 | 1 | 2-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 540 | 1 | 3-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 541 | 1 | 4-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 542 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 543 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 544 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 545 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 546 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 547 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 548 | 1 | 4-tBu-Ph | 5-CF ₃ | |
| 549 | 1 | 2-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 550 | 1 | 3-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 551 | 1 | 4-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 552 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 553 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 554 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 555 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 556 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 557 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 558 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 559 | 1 | α -Naph | 5-CF ₃ | |
| 560 | 1 | β -Naph | 5-CF ₃ | |
| 561 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-CF ₃ | |

表 1 8

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 562 | 2 | Ph | 5-CF ₃ | |
| 563 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 564 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 565 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 566 | 2 | 2-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 567 | 2 | 3-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 568 | 2 | 4-F-Ph | 5-CF ₃ | |
| 569 | 2 | 2-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 570 | 2 | 3-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 571 | 2 | 4-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 572 | 2 | 2-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 573 | 2 | 3-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 574 | 2 | 4-Br-Ph | 5-CF ₃ | |
| 575 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 576 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 577 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 578 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 579 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 580 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 581 | 2 | 4-tBu-Ph | 5-CF ₃ | |
| 582 | 2 | 2-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 583 | 2 | 3-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 584 | 2 | 4-OPh-Ph | 5-CF ₃ | |
| 585 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 586 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 587 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 588 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 589 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-CF ₃ | |
| 590 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 591 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-CF ₃ | |
| 592 | 2 | α -Naph | 5-CF ₃ | |
| 593 | 2 | β -Naph | 5-CF ₃ | |
| 594 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-CF ₃ | |

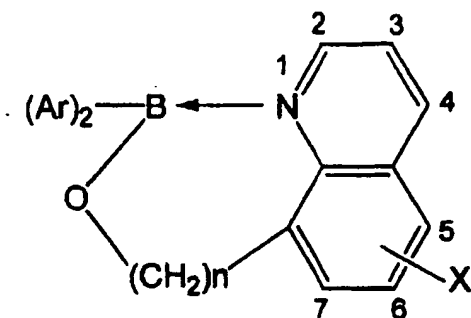
表 1 9

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 628 | 1 | Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 629 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 630 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 631 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 632 | 1 | 2-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 633 | 1 | 3-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 634 | 1 | 4-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 635 | 1 | 2-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 636 | 1 | 3-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 637 | 1 | 4-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 638 | 1 | 2-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 639 | 1 | 3-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 640 | 1 | 4-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 641 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 642 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 643 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 644 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 645 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 646 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 647 | 1 | 4-tBu-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 648 | 1 | 2-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 649 | 1 | 3-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 650 | 1 | 4-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 651 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 652 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 653 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 654 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 655 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 656 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 657 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 658 | 1 | α -Naph | 2,4-Cl ₂ | |
| 659 | 1 | β -Naph | 2,4-Cl ₂ | |
| 660 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2,4-Cl ₂ | |

表 20

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 661 | 2 | Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 662 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 663 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 664 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 665 | 2 | 2-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 666 | 2 | 3-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 667 | 2 | 4-F-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 668 | 2 | 2-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 669 | 2 | 3-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 670 | 2 | 4-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 671 | 2 | 2-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 672 | 2 | 3-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 673 | 2 | 4-Br-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 674 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 675 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 676 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 677 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 678 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 679 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 680 | 2 | 4-tBu-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 681 | 2 | 2-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 682 | 2 | 3-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 683 | 2 | 4-OPh-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 684 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 685 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 686 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 687 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 688 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 689 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 690 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2,4-Cl ₂ | |
| 691 | 2 | α -Naph | 2,4-Cl ₂ | |
| 692 | 2 | β -Naph | 2,4-Cl ₂ | |
| 693 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2,4-Cl ₂ | |

以下の実施例 7 ～ 9 は下記式で示される化合物に関する：



実施例 7

化合物 697 (式中、 n は0、 Ar は4-メチルフェニル、 X は水素) の合成
 ジ (4-メチル) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル3.04 g
 (0.012mol) と 8-オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様
 に反応、処理し白色結晶の化合物 697 を3.28g (収率81%) 得た。

融点: 203~205°C

実施例 8

化合物 708 (式中、 n は0、 Ar は3-トリフルオロメチルフェニル、 X は水
 素) の合成

ジ (3-トリフロロメチル) -フェニルボロン酸エタノールアミンエステル
 2.77 g (0.012mol) と 8-オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物 1 の合成法
 と同様に反応、処理し白色結晶の化合物 708 を4.31g (収率80.8%) 得た。

融点: 130~132°C

実施例 9

化合物 724 (式中、 n は0、 Ar は α -ナフチル、 X は水素) の合成

ジ- α -ナフチルボロン酸エタノールアミンエステル3.90 g (0.012mol) と 8-
 オキシキノリン2.61g (0.018mol) を化合物 1 の合成法と同様に反応、処理し白色
 結晶の化合物 724 を4.11g (収率86.3%) 得た。

融点: 225~226°C

上記実施例 7～9 を参考にすれば、以下の表 2 1～3 2 中に示される化合物を製することができる。

表 2 1

5

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---------|
| 694 | 0 | Ph | H | 206-207 |
| 695 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | H | 189-191 |
| 696 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | H | 165-167 |
| 697 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | H | 203-205 |
| 698 | 0 | 2-F-Ph | H | |
| 699 | 0 | 3-F-Ph | H | |
| 700 | 0 | 4-F-Ph | H | 167-169 |
| 701 | 0 | 2-Cl-Ph | H | |
| 702 | 0 | 3-Cl-Ph | H | |
| 703 | 0 | 4-Cl-Ph | H | 181-182 |
| 704 | 0 | 2-Br-Ph | H | |
| 705 | 0 | 3-Br-Ph | H | |
| 706 | 0 | 4-Br-Ph | H | |
| 707 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | H | |
| 708 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | H | 130-132 |
| 709 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | H | |
| 710 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | H | 199-200 |
| 711 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | H | |
| 712 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | H | 212-214 |
| 713 | 0 | 4-tBu-Ph | H | |
| 714 | 0 | 2-OPh-Ph | H | |
| 715 | 0 | 3-OPh-Ph | H | |
| 716 | 0 | 4-OPh-Ph | H | |
| 717 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 718 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 719 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 720 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | |
| 721 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | |
| 722 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 723 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 724 | 0 | α -Naph | H | 225-226 |
| 725 | 0 | β -Naph | H | |
| 726 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | |

表 2 2

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---|---------|
| 727 | 1 | Ph | H | |
| 728 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | H | |
| 729 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | H | |
| 730 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | H | |
| 731 | 1 | 2-F-Ph | H | |
| 732 | 1 | 3-F-Ph | H | |
| 733 | 1 | 4-F-Ph | H | |
| 734 | 1 | 2-Cl-Ph | H | |
| 735 | 1 | 3-Cl-Ph | H | |
| 736 | 1 | 4-Cl-Ph | H | |
| 737 | 1 | 2-Br-Ph | H | |
| 738 | 1 | 3-Br-Ph | H | |
| 739 | 1 | 4-Br-Ph | H | |
| 740 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | H | |
| 741 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | H | |
| 742 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | H | |
| 743 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | H | |
| 744 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | H | |
| 745 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | H | |
| 746 | 1 | 4-tBu-Ph | H | |
| 747 | 1 | 2-OPh-Ph | H | |
| 748 | 1 | 3-OPh-Ph | H | |
| 749 | 1 | 4-OPh-Ph | H | |
| 750 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 751 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | H | |
| 752 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 753 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | H | |
| 754 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | H | |
| 755 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 756 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | H | |
| 757 | 1 | α -Naph | H | |
| 758 | 1 | β -Naph | H | |
| 759 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | H | |

表 2 3

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 760 | 0 | Ph | 5-Cl | |
| 761 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 762 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 763 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 764 | 0 | 2-F-Ph | 5-Cl | |
| 765 | 0 | 3-F-Ph | 5-Cl | |
| 766 | 0 | 4-F-Ph | 5-Cl | |
| 767 | 0 | 2-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 768 | 0 | 3-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 769 | 0 | 4-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 770 | 0 | 2-Br-Ph | 5-Cl | |
| 771 | 0 | 3-Br-Ph | 5-Cl | |
| 772 | 0 | 4-Br-Ph | 5-Cl | |
| 773 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 774 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 775 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 776 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 777 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 778 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 779 | 0 | 4-tBu-Ph | 5-Cl | |
| 780 | 0 | 2-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 781 | 0 | 3-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 782 | 0 | 4-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 783 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-Cl | |
| 784 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-Cl | |
| 785 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 786 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 787 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 788 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 789 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 790 | 0 | α -Naph | 5-Cl | |
| 791 | 0 | β -Naph | 5-Cl | |
| 792 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-Cl | |

表 2 4

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 793 | 1 | Ph | 5-Cl | |
| 794 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 795 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 796 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 797 | 1 | 2-F-Ph | 5-Cl | |
| 798 | 1 | 3-F-Ph | 5-Cl | |
| 799 | 1 | 4-F-Ph | 5-Cl | |
| 800 | 1 | 2-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 801 | 1 | 3-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 802 | 1 | 4-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 803 | 1 | 2-Br-Ph | 5-Cl | |
| 804 | 1 | 3-Br-Ph | 5-Cl | |
| 805 | 1 | 4-Br-Ph | 5-Cl | |
| 806 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 807 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 808 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 809 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 810 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 811 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 812 | 1 | 4-tBu-Ph | 5-Cl | |
| 813 | 1 | 2-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 814 | 1 | 3-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 815 | 1 | 4-OPh-Ph | 5-Cl | |
| 816 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-Cl | |
| 817 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-Cl | |
| 818 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 819 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 820 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-Cl | |
| 821 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 822 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-Cl | |
| 823 | 1 | α -Naph | 5-Cl | |
| 824 | 1 | β -Naph | 5-Cl | |
| 825 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-Cl | |

表 2 5

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 826 | 0 | Ph | 7-Cl | |
| 827 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 828 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 829 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 830 | 0 | 2-F-Ph | 7-Cl | |
| 831 | 0 | 3-F-Ph | 7-Cl | |
| 832 | 0 | 4-F-Ph | 7-Cl | |
| 833 | 0 | 2-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 834 | 0 | 3-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 835 | 0 | 4-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 836 | 0 | 2-Br-Ph | 7-Cl | |
| 837 | 0 | 3-Br-Ph | 7-Cl | |
| 838 | 0 | 4-Br-Ph | 7-Cl | |
| 839 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 840 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 841 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 842 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 843 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 844 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 845 | 0 | 4-tBu-Ph | 7-Cl | |
| 846 | 0 | 2-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 847 | 0 | 3-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 848 | 0 | 4-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 849 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 7-Cl | |
| 850 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 7-Cl | |
| 851 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 852 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 853 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 854 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 855 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 856 | 0 | α -Naph | 7-Cl | |
| 857 | 0 | β -Naph | 7-Cl | |
| 858 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 7-Cl | |

表 2 6

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|------|---------|
| 859 | 1 | Ph | 7-Cl | |
| 860 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 861 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 862 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 863 | 1 | 2-F-Ph | 7-Cl | |
| 864 | 1 | 3-F-Ph | 7-Cl | |
| 865 | 1 | 4-F-Ph | 7-Cl | |
| 866 | 1 | 2-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 867 | 1 | 3-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 868 | 1 | 4-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 869 | 1 | 2-Br-Ph | 7-Cl | |
| 870 | 1 | 3-Br-Ph | 7-Cl | |
| 871 | 1 | 4-Br-Ph | 7-Cl | |
| 872 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 873 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 874 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 875 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 876 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 877 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 878 | 1 | 4-tBu-Ph | 7-Cl | |
| 879 | 1 | 2-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 880 | 1 | 3-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 881 | 1 | 4-OPh-Ph | 7-Cl | |
| 882 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 7-Cl | |
| 883 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 7-Cl | |
| 884 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 885 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 886 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 7-Cl | |
| 887 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 888 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 7-Cl | |
| 889 | 1 | α -Naph | 7-Cl | |
| 890 | 1 | β -Naph | 7-Cl | |
| 891 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 7-Cl | |

表 2 7

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 892 | 0 | Ph | 2-CH ₃ | |
| 893 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 894 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 895 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 896 | 0 | 2-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 897 | 0 | 3-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 898 | 0 | 4-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 899 | 0 | 2-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 900 | 0 | 3-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 901 | 0 | 4-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 902 | 0 | 2-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 903 | 0 | 3-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 904 | 0 | 4-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 905 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 906 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 907 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 908 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 909 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 910 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 911 | 0 | 4-tBu-Ph | 2-CH ₃ | |
| 912 | 0 | 2-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 913 | 0 | 3-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 914 | 0 | 4-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 915 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 916 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 917 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 918 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 919 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 920 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 921 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 922 | 0 | α -Naph | 2-CH ₃ | |
| 923 | 0 | β -Naph | 2-CH ₃ | |
| 924 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2-CH ₃ | |

表 2 8

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|-------------------|---------|
| 925 | 2 | Ph | 2-CH ₃ | |
| 926 | 2 | 2-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 927 | 2 | 3-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 928 | 2 | 4-CH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 929 | 2 | 2-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 930 | 2 | 3-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 931 | 2 | 4-F-Ph | 2-CH ₃ | |
| 932 | 2 | 2-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 933 | 2 | 3-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 934 | 2 | 4-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 935 | 2 | 2-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 936 | 2 | 3-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 937 | 2 | 4-Br-Ph | 2-CH ₃ | |
| 938 | 2 | 2-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 939 | 2 | 3-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 940 | 2 | 4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 941 | 2 | 2-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 942 | 2 | 3-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 943 | 2 | 4-OCH ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 944 | 2 | 4-tBu-Ph | 2-CH ₃ | |
| 945 | 2 | 2-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 946 | 2 | 3-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 947 | 2 | 4-OPh-Ph | 2-CH ₃ | |
| 948 | 2 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 949 | 2 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 950 | 2 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 951 | 2 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 952 | 2 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 2-CH ₃ | |
| 953 | 2 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 954 | 2 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 2-CH ₃ | |
| 955 | 2 | α -Naph | 2-CH ₃ | |
| 956 | 2 | β -Naph | 2-CH ₃ | |
| 957 | 2 | 4-Me ₃ Si-Ph | 2-CH ₃ | |

表 2 9

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 958 | 0 | Ph | 5-SO ₃ H | |
| 959 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 960 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 961 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 962 | 0 | 2-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 963 | 0 | 3-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 964 | 0 | 4-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 965 | 0 | 2-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 966 | 0 | 3-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 967 | 0 | 4-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 968 | 0 | 2-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 969 | 0 | 3-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 970 | 0 | 4-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 971 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 972 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 973 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 974 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 975 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 976 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 977 | 0 | 4-tBu-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 978 | 0 | 2-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 979 | 0 | 3-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 980 | 0 | 4-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 981 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 982 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 983 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 984 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 985 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 986 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 987 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 988 | 0 | α -Naph | 5-SO ₃ H | |
| 989 | 0 | β -Naph | 5-SO ₃ H | |
| 990 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-SO ₃ H | |

表 3 0

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 991 | 0 | Ph | 5-SO ₃ H | |
| 992 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 993 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 994 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 995 | 0 | 2-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 996 | 0 | 3-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 997 | 0 | 4-F-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 998 | 0 | 2-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 999 | 0 | 3-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1000 | 0 | 4-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1001 | 0 | 2-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1002 | 0 | 3-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1003 | 0 | 4-Br-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1004 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1005 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1006 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1007 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1008 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1009 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1010 | 0 | 4-tBu-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1011 | 0 | 2-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1012 | 0 | 3-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1013 | 0 | 4-OPh-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1014 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1015 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1016 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1017 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1018 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1019 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1020 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5-SO ₃ H | |
| 1021 | 0 | α -Naph | 5-SO ₃ H | |
| 1022 | 0 | β -Naph | 5-SO ₃ H | |
| 1023 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5-SO ₃ H | |

表 3 1

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 1024 | 0 | Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1025 | 0 | 2-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1026 | 0 | 3-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1027 | 0 | 4-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1028 | 0 | 2-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1029 | 0 | 3-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1030 | 0 | 4-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1031 | 0 | 2-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1032 | 0 | 3-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1033 | 0 | 4-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1034 | 0 | 2-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1035 | 0 | 3-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1036 | 0 | 4-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1037 | 0 | 2-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1038 | 0 | 3-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1039 | 0 | 4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1040 | 0 | 2-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1041 | 0 | 3-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1042 | 0 | 4-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1043 | 0 | 4-tBu-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1044 | 0 | 2-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1045 | 0 | 3-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1046 | 0 | 4-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1047 | 0 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1048 | 0 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1049 | 0 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1050 | 0 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1051 | 0 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1052 | 0 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1053 | 0 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1054 | 0 | α -Naph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1055 | 0 | β -Naph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1056 | 0 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5,7-Cl ₂ | |

表 3 2

| 化合物 No. | n | Ar | X | 融点 (°C) |
|---------|---|--|---------------------|---------|
| 1057 | 1 | Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1058 | 1 | 2-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1059 | 1 | 3-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1060 | 1 | 4-CH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1061 | 1 | 2-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1062 | 1 | 3-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1063 | 1 | 4-F-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1064 | 1 | 2-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1065 | 1 | 3-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1066 | 1 | 4-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1067 | 1 | 2-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1068 | 1 | 3-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1069 | 1 | 4-Br-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1070 | 1 | 2-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1071 | 1 | 3-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1072 | 1 | 4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1073 | 1 | 2-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1074 | 1 | 3-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1075 | 1 | 4-OCH ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1076 | 1 | 4-tBu-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1077 | 1 | 2-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1078 | 1 | 3-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1079 | 1 | 4-OPh-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1080 | 1 | 2,4-Cl ₂ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1081 | 1 | 3,4-Cl ₂ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1082 | 1 | 2-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1083 | 1 | 2-CF ₃ ,3-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1084 | 1 | 3-CF ₃ ,4-Cl-Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1085 | 1 | 3-Cl,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1086 | 1 | 3-CF ₃ ,4-CF ₃ -Ph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1087 | 1 | α -Naph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1088 | 1 | β -Naph | 5,7-Cl ₂ | |
| 1089 | 1 | 4-Me ₃ Si-Ph | 5,7-Cl ₂ | |

本発明化合物は、それぞれの分野でよく知られた方法に従って製剤化して家禽
 5 用コキシジウム予防剤および治療剤とすることができる。即ち、本発明の化合物
 を、単味または通常この種の薬剤に使用される適当な担体と共に、場合により賦
 形剤、崩壊剤、滑沢剤コーティング等を用いて、散剤、粒剤、溶液、懸濁液、ブ

レミックス、カプセル、乳剤、錠剤等の剤型に調製することができる。

本発明の製剤に用いられる担体は通常、家禽の飼料または飲水に添加できるものであれば、特に制限されないが、水、乳糖、ショ糖、タルク、コロイド状シリカ、ペクチン、小麦粉、米ぬか、トウモロコシ粉、大豆、油粕、ひきわり澱粉、
5 その他市販の家禽用飼料等が例示される。

本発明化合物の投与量は、飼料に添加して使用する場合には、一般に家禽飼料中に、少なくとも原体換算で0.1～500ppm、好ましくは0.5～100ppmの濃度になるように配合すればよい。また、飲料水に添加して使用する場合には、飲料水中の本発明化合物の濃度は上記飼料中の濃度の約半分で十分な効果を示すことができる。
10

さらに、本発明の化合物は、既知家禽用抗コクシジウム剤、寄生虫駆除剤、感染症予防剤または成長促進剤等を含む動物用医薬品と併用することもできる。

試験例

以下に示す試験例により、本発明化合物の抗コクシジウム活性を証明した。
15

本発明の家禽用抗コクシジウム剤のインビトロ (in vitro) 試験は下記のようにして行った。

試験例 1

ニワトリ腎臓 (CK) 培養細胞におけるコクシジウムのインビトロ (in vitro) 増殖抑制活性
20

1. 細胞の処置

公知の方法によってSPFヒナから無菌的に腎臓を採材、トリプシン消化し細胞を洗浄、細胞数を調整後、CO₂インキュベータで37℃、72時間培養し単層細胞を得た。単層細胞に所定濃度に希釈した被検化合物および人工脱殻したアイメリア・テネラのスポロゾイトを接種、40℃、48時間培養した。培養後の細胞は、アルコール固定、ギムザ染色をし、以下観察をした。
25

2. 観察および判定

倒立顕微鏡下においてニワトリ腎臓細胞質内で分裂、増殖した第1代シizont

(成熟および未成熟)を観察、そのシizont数から無処理スポロゾイト接種対照群に対する原虫の増殖抑制率を求めた。

また、同時に細胞毒性 (CPE) も観察し、(－) ～ (＋＋＋) の4段階評価を行った：－：無処理対照と差なし、＋：軽度の変化、＋＋：中度の変化、＋＋＋：完全に細胞が脱落 (原虫の観察は不能)。

得られた結果を以下の表33に示す。

試験例2

ニワトリヒナにおけるコクシジウム症予防・治療効果のインビボ (in vivo) 判定

本発明化合物のアイメリア・テネラに対する有効性 (抗コクシジウム効果) を200ppmまたは400ppm飼料添加連続投与において検討した。

7～10日令の白色レグホンのヒナ3羽を1群とし、被検化合物を添加した飼料を投与した。投与開始2日目にアイメリア・テネラの胞子形成オーシストを、一羽あたり50,000個感染させた。被検化合物は9日間連続投与し、その間の血便排泄程度、生存率、相対増体率を観察し、感染8日目に剖検して盲腸病変を観察し、盲腸病変値を算出した。

本試験の判定基準は次の通りである。

相対増体率：

試験群の体重増加量÷無感染対照群の体重増加量×100 (%) で表示。

血便の排泄：

試験期間中に排泄される血便の排泄程度を以下の4段階で評価。表中、「d」はオーシスト投与後の日数を表す。

－：血便排泄を認めない。

＋：軽度の血便排泄を認める。

＋＋：中度の血便排泄を認める。

＋＋＋：感染対照群と同程度の血便排泄を認める。

盲腸病変値：

メルク (Merck) の検定法による。

生存したヒナを感染 8 日後に剖検し、盲腸病変を肉眼的に観察し、その病変程度を 0 ～ 4 に分けて（病変なしを 0、重度のものを 4 とし）その間の強度を測定し、5 羽分の平均値で表す。

試験結果を、未処置感染対照群および未処置無感染対照群と比較して表 3 3 に

5 示す。

表 3 3

| <i>in vitro</i> 抗原虫活性(<i>E.tenella</i>) | | | | <i>in vivo</i> 抗コクシジウム効果(<i>E.tenella</i>) | | | | | | | |
|---|---------------|----------------|----------------|--|-------------------|-------|-----|-----|------------|--------|-------------------|
| Comp.No | 濃度(μg/ml) | | | 投与量 (ppm in feed) | 相対増 体重率 (%) | 血便の排泄 | | | 死亡率 (%) | OPG値 | 盲腸 病変値 (6d) |
| | 10 % (CPE) | 1.0 % (CPE) | 0.1 % (CPE) | | | 4 | 5 | 6d | | | |
| 1 | <0 (-) | 0.2 (-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 694 | (+++) | 12.5(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 199 | 39.6(-) | <0 (-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 232 | 32.2(-) | 0.9(-) | 6.0(-) | | | | | | | | |
| 31 | 69.7(-) | 0 (-) | <0 (-) | 400 | 68.8 | ± | +++ | ++ | 0/3 | (測定せず) | 4.0 |
| 724 | (+++) | 100 (-) | <0 (-) | 400 | 58.9 | ± | +++ | ++ | 0/3 | " | 4.0 |
| 229 | 77.0(-) | <0 (-) | <0 (-) | 400 | 56.5 | + | +++ | ++ | 0/3 | " | 4.0 |
| 262 | 60.4(-) | 0.9(-) | <0 (-) | 400 | 53.8 | ± | +++ | +++ | 0/3 | " | 4.0 |
| 2 | <0 (-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 695 | (+++) | (+++) | <0 (-) | 400 | 61.5 | + | +++ | +++ | 0/3 | " | 3.7 |
| 200 | <0 (-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 233 | <0 (-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 3 | 19.3(-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 696 | (+++) | 90.7(+) | 30.5(-) | 400 | 61.5 | + | +++ | ++ | 1/3 | " | 4.0 |
| 201 | 71.3(-) | <0(-) | <0 (-) | 400 | 71.8 | + | +++ | ++ | 1/3 | " | 4.0 |
| 4 | <0 (-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 697 | (+++) | 65.1(±) | <0 (-) | 400 | 76.9 | ± | +++ | +++ | 1/3 | " | 3.7 |
| 202 | 44.2(-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 710 | (+++) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 215 | 4.5(-) | <0(-) | 1.8(-) | | | | | | | | |
| 19 | <0 (-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 712 | (+++) | 28.8(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 217 | 14.5(-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 250 | <0 (-) | 2.4(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 703 | (+++) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 208 | 17.2(-) | <0(-) | 1.8 (-) | | | | | | | | |
| 241 | 14.0(-) | <0(-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 10 | 100 (+) | 12.1(-) | <0 (-) | 400 | 82.5 | — | — | — | 0/3 | " | 0.0(H) |
| 15 | 99.6(+) | <0 (-) | <0 (-) | 200 | 25.7 | + | +++ | ++ | 0/3 | " | 4.0 |
| 708 | (+++) | 94.7(++) | 16.6(-) | 400 | 42.4 | + | ++ | +++ | 0/3 | " | 4.0 |
| 213 | 100 (+) | 13.0(-) | <0 (-) | 400 | 57.4 | ± | ++ | ++ | 0/3 | " | 3.7 |
| 246 | 100 (+) | 14.8 (-) | <0 (-) | 400 | 82.5 | — | + | ++ | 0/3 | " | 3.3(S) |
| 7 | <0 (-) | <0 (-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 700 | (+++) | 99.8 (++) | 30.6(-) | | | | | | | | |
| 205 | 33.2(±) | <0 (-) | <0 (-) | | | | | | | | |
| 238 | 27.1(±) | <0 (-) | <0 (-) | | | | | | | | |

結果： 化合物 1 0 および化合物 2 4 6 等に明らかな臨床症状、相対増体率およ

び盲腸病変値等の改善が認められた。特に、化合物10は血便の排泄を全く認めず盲腸も正常で感染の所見を全く認めなかった。

試験例3

5 化合物10についてのさらなるインビボ (in vivo) 試験

試験例1および2により良好な成績を示した化合物10について、さらに詳細にインビボ試験を行った。

即ち、試験例2と同様の手法により、化合物10のプロイラーヒナにおけるアイメリア・テネラおよびアイメリア・アセルブリーナに対する有効性を調べた。

10 なお、ここでは感染6日目の糞便1gあたりに存在するオーシスト数であるOPG値も測定した。OPG値の測定方法は、糞便を採取しよく混和し、その2gを蒸留水を用いて20倍に希釈し、フックスローゼンタール計算盤を用いてカウントし、単位gあたりのOPG値を算出した。OPG値はその多少によってその後の感染の程度がある程度推定できる。OPG値が高くなるに従いより重篤な症状となるのが一般である。

15 得られた結果を表34および表35に示す。

表34

アイメリア・テネラに対する抗コクジウム効果 (プロイラーヒナ)

| Comp.No | 投与量 (ppm in feed) | 相対増体率 (-1~8d) % | 血便の排泄 | | | | 死亡率 (/) | OPG値 | | 盲腸 病変値 (x~◎) (8d) | 判定 |
|---------|-------------------------|-----------------------|-------|-----|----|----|------------|---------------------|---------------------|-------------------------|-------|
| | | | 4 | 5 | 6 | 7d | | 6d | 7d | | |
| 化合物10 | 200 | 70.2(T) | - | - | - | - | 0/3 | 0 | 0 | 0 | ◎(T)* |
| | 100 | 101.0 | - | + | + | ± | 0/3 | 1.0x10 ⁵ | 6.3x10 ⁵ | 1.7* | △ * |
| | 50 | 54.8 | + | +++ | ++ | + | 0/3 | 2.9x10 ⁵ | 9.8x10 ⁴ | 4.0 | x |
| | 25 | 65.0 | + | +++ | ++ | - | 0/3 | 1.3x10 ⁵ | 4.3x10 ⁴ | 4.0 | x |
| 感染対照 | 0 | 49.0 | ++ | +++ | ++ | ± | 1/3 | 1.9x10 ⁵ | 1.3x10 ⁵ | 4.0 | |
| 正常対照 | 0 | 100 | - | - | - | - | 0/3 | 0 | 0 | 0 | |

20 * 下痢症状(+)

表 3 5

アイメリア・アセルブリーナに対する抗コクシジウム効果 (ブライーヒナ)

| Comp.No | 投与量 (ppm in feed) | 相対増体率 (-1~5d) % | 粘液便の排泄 | | | 死亡数 (/) | OPG値 | | 判定 (×~◎) |
|---------|-------------------------|-----------------------|--------|----|-----|------------|-------------------|-------------------|-------------|
| | | | 3 | 4 | 5d | | 4d | 5d | |
| 化合物10 | 200 | 82.3(T) | - | - | - | 0/3 | 0 | 0 | ◎(T)* |
| | 100 | 80.6 | - | + | ++ | 0/3 | 6.6×10^6 | 2.8×10^6 | △ * |
| | 50 | 67.8 | - | ++ | +++ | 0/3 | 5.9×10^6 | 1.7×10^6 | × |
| | 25 | 51.6 | - | ++ | +++ | 0/3 | 1.9×10^7 | 6.2×10^6 | × |
| 感染対照 | 0 | 54.9 | - | ++ | +++ | 0/3 | 1.7×10^7 | 7.5×10^6 | |
| 正常対照 | 0 | 100 | - | - | - | 0/3 | 0 | 0 | |

* 下痢症状(+)

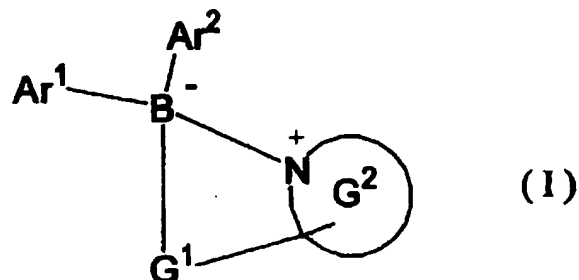
- 5 結果：アイメリア・テネラおよびアイメリア・アセルブリーナ兩種に対して飼料中100ppm投与で明らかな臨床症状、相対増体率および盲腸病変値（アイメリア・テネラのみ）の改善が認められ、化合物10が優れた抗コクシジウム効果を有することが確認された。

発明の効果

- 10 本発明化合物は、上記試験例から明らかなように、コクシジウムを感染させたニワトリヒナにおいて、相対増体率減少の抑制、血便排泄の抑制、オーシスト個数（O. P. G.）の減少および盲腸病変値の改善等の強い抗コクシジウム活性を示す。また、本発明化合物は、死亡個体のデータからも明らかなように低毒性であるので、ニワトリをはじめ、七面鳥、アヒル等の家禽類およびウシ、ブタ等の
- 15 家畜類のコクシジウム症に対する予防および治療剤として有用である。

請求の範囲

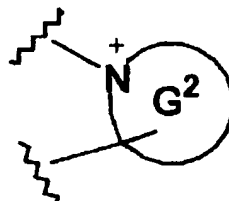
1. 一般式 (I) :



- 5 [式中、 Ar^1 および Ar^2 はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

- G^1 は、式： $-A-$ 、 $-A-CR^1R^2-$ または $-A-CR^3R^4-CR^5R^6-$ で表される基（式中、 A は酸素原子または硫黄原子、 $R^1 \sim R^6$ はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい脂肪族炭化水素基、 $-O-$ （置換されていてもよい脂肪族炭化水素基）、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^1 と R^2 、 R^3 と R^4 および／もしくは R^5 と R^6 が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する）；
- 10
- 15

式：



で示される基は置換されていてもよいアザ環式基；

- ただし、 B^- 、 G^1 および G^2 から構成される環のうち最小環は5員環または6員環であるものとする]
- 20

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する動物（ヒト

を除く) 用医薬組成物。

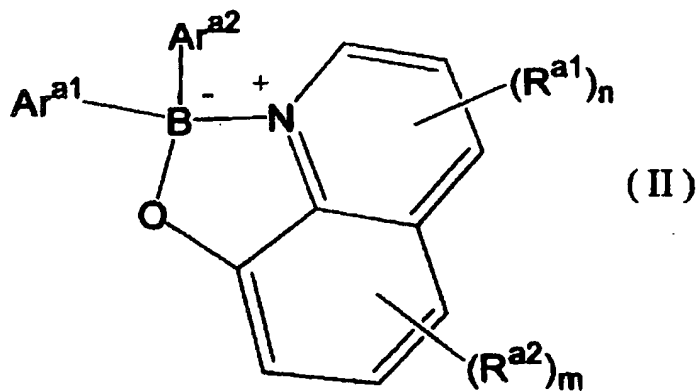
2. 一般式 (I) 中、 Ar^1 および Ar^2 が同一であり、ともに置換されていてもよいアリール基である請求項 1 記載の医薬組成物。

3. 一般式 (I) 中、 G^1 が式: $-O-$ 、 $-O-CR^1R^2-$ または $-O-CR^3R^4-CR^5R^6-$ で表される基 (式中、 $R^1 \sim R^6$ はそれぞれ同一または異なって水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキルオキシ基、または置換されていてもよい低級アルケニルオキシ基) である請求項 1 または 2 記載の医薬組成物。

4. 一般式 (I) [式中、各記号の定義は請求項 1 と同義] で表される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する抗原虫剤。

5. 一般式 (I) [式中、各記号の定義は請求項 1 と同義] で表される化合物もしくはその塩またはそれらの水和物を含有する抗コクシジウム剤。

6. 一般式 (II) :



[式中、 Ar^{a1} は、置換されていてもよいアリール基；

Ar^{a2} は置換されていてもよい縮合アリール基；

R^{a1} および R^{a2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換され

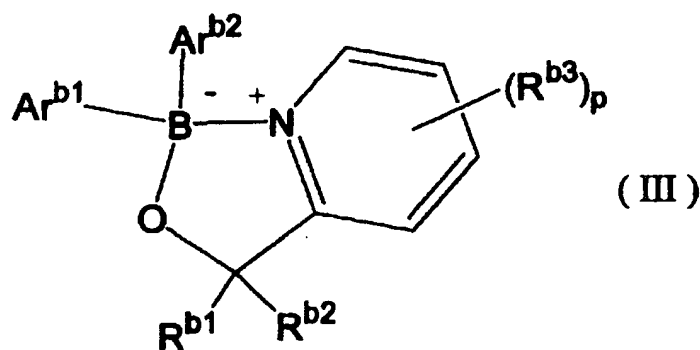
ていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基；

n および m は同一または異なって 0～3 のいずれかの整数を示す。

ただし、n および m がともに 0 であるとき、 Ar^{b1} および Ar^{b2} がともに 1 位がナフタレン-1-イルで置換されているナフタレン-2-イルである場合を除く。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

7. 一般式 (III) :



[式中、 Ar^{b1} および Ar^{b2} は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

R^{b1} および R^{b2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^{b1} と R^{b2} が一緒になってオキシ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R^{b3} はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ

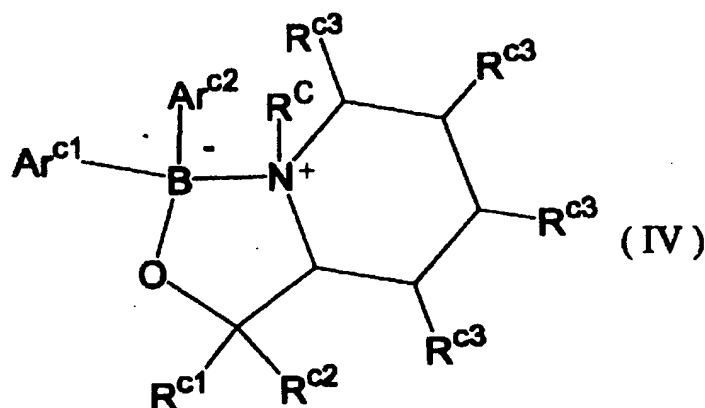
基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、または置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

p は 0 ～ 4 のいずれかの整数を示す。

ただし、p が 0、 R^{b1} および R^{b2} がともに水素ならびに Ar^{b1} および Ar^{b2} がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、 Ar^{b1} および Ar^{b2} における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

8. 一般式 (IV) :



[式中、 Ar^{c1} および Ar^{c2} はそれぞれ独立して、置換されていてもよい環式基；

R^{c1} および R^{c2} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または

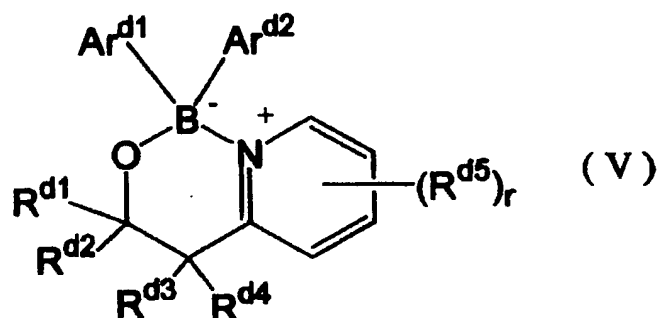
R^{c1} と R^{c2} が一緒になってオキソ、置換されていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

R^{c3} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

R^c は水素原子または低級アルキルを示す]

で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

9. 一般式 (V) :



[式中、 Ar^{d1} および Ar^{d2} は同一または異なって置換されていてもよいアリール基；

R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} および R^{d4} はそれぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または R^{d1} と R^{d2} および／または R^{d3} と R^{d4} が一緒になってオキソ、置換され

ていてもよいメチレンもしくは置換されていてもよいイミノを形成する；

- 5 R^{d5} はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、ハロゲン化低級アルキル基、ハロゲン化低級アルケニル基、置換されていてもよいアラルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、ハロゲン化低級アルコキシ基、ハロゲン化低級アルケニルオキシ基、アシルオキシ、置換されていてもよいフェニルオキシ、置換されていてもよいアラルキルオキシ、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよいスルホ基、もしくは置換されていてもよいアリール基であるか、または隣接する基と一緒になって縮合環を形成していてもよい；

- 10 r は0～4のいずれかの整数を示す。

ただし、 r が0、 R^{d1} 、 R^{d2} 、 R^{d3} および R^{d4} がすべて水素ならびに Ar^{d1} および Ar^{d2} がハロゲン原子または低級アルキル基によって置換されているフェニルであるとき、 Ar^{d1} および Ar^{d2} における該フェニルはハロゲン原子および低級アルキル基以外の置換基によってさらに置換されているものとする。]

- 15 で表わされる化合物もしくはその塩またはそれらの水和物。

10. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する動物（ヒトを除く）用医薬組成物。

11. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する抗原虫剤。

- 20 12. 請求項6から9までのいずれかに記載の化合物を含有する抗コキシジウム剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl.⁷ A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int. Cl.⁷ A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X Y | TRUJILLO, Jose et al. X-ray crystallographic study of boroxazolidones obtained from L-ornithine, L-methionine, kainic acid and 2,6-pyridinedicarboxylic acid, J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 571, No. 1, pp. 21-29, especially, page 22 | 7, 8 1-5, 10-12 |
| X Y | HOPFL, Herbert et al, Study of cyclic borinates obtained from piperidine- and piperazine alcohols by spectroscopic methods and X-ray crystallography, J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 553, No. 1-2, pp. 221-239, especially, pages 222, 227 | 8 1-5, 10-12 |
| X Y | DOROKHOV, V. A. et al, Boron chelate complexes with some enaminones and diketones containing pyridine moiety and their mutual transformation in solutions, Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim., 1996, No. 3, pp. 710-714, especially, page 712 | 7 1-5, 10-12 |
| X Y | Yuan, Guo-Zheng et al, Single site transarylation of 2,2'-dimetalized 1,1'-binaphthyl to aminochloroborates and synthesis of 2-binaphthyl boron compounds, Youji Huaxue, 1996, Vol. 16, No. 2, pp. 139-144, especially, pages 139, 140 | 6 1-5, 10-12 |

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
22 February, 2000 (22.02.00)Date of mailing of the international search report
29 February, 2000 (29.02.00)Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X Y | US, 5348947, A (PATEL, Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document | 7 1-5,10-12 |
| X Y | US, 5348947, A (PATEL, Bomi P.), 20 September, 1994 (20.09.94) (Family: none) the whole document | 7 1-5,10-12 |
| X Y | TORRES, Luis Alfonso et al, Rotating-bomb combustion calorimetry and the standard enthalpies of formation of two borinic esters, J. Chem. Thermodyn. Vol.1994, No.26, No.4, pp.337-43, especially, page 338 | 7,9 1-5,10-12 |
| X Y | FARFAN, Norberto et al, Through-bond modulation of N .fwdarw.B ring formation shown by NMR and x-ray diffraction studies of borate derivatives of pyridyl alcohols, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2, 1992, No.4, pp.527-32, especially, page 527 | 7,9 1-5,10-12 |
| X Y | LIU, Xiaolan et al, Structure studies of bis(substituted)-2-(substituted)-8-hydroxyquinolines, Youji Huaxue, 1991, Vol.11, No.4, pp.410-15, especially, pages 412,414 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | SHAN, Zixing et al, Synthesis of aromatic nitrogen-containing heterocyclic derivatives of asymmetric diarylborinic acids, Wuhan Daxue Xuebao, Ziran Kexueban, 1990, No.3, pp.67-72, especially, page 68 | 6,7 1-5,10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Ligand substitution reaction of diarylboron chelates, Wuji Huaxue Xuebao, 1990, Vol.6, No.3, pp.314-18, especially, pages 314,315 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Studies on antitumor boron compounds. V. Fluorine- and methoxy-substituted diphenylboron chelates with N,O-bidentate ligands, Youji Huaxue, 1989, Vol.9, No.3, pp.226-9, especially, page 227 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Boron compounds. XX. Synthesis and conversion of ethanalamine-tri(2-furyl)borane, Youji Huaxue 1987, No.2, pp.146-9, especially, page 148 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Concurrent reaction of the phenol and the 1,3-dicarbonyl function under Mannich conditions, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.11, pp.767-71, especially, Page 767 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Reaction of functional epoxycarbonyl compounds opposed to hydrogen chloride, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.6, pp.387-93, especially, page 389 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Real structures of drugs seemingly derived from -(8-hydroxyquinol-5-yl)-3-phenylpropane-1, 3-dione, Pharmazie, 1985, Vol.40, No.5, pp.307-11, especially, page 309 | 6 1-5,10-12 |
| X Y | LIN, Kai et al, Synthesis and antitumor activity of organyloxy-diarylborane chelates containing quinoline ring, Yiyao Gongye, 1985, Vol.16, No.11, pp.500-2, especially, page 501 | 6 1-5,10-12 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP99/07139

| C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT | | |
|---|---|-----------------------|
| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
| X Y | BAILEY, P.J. et al, Boron-containing antibacterial agents: effects on growth and morphology of bacteria under various culture conditions, Antimicrob. Agents Chemother., 1980, Vol.17, No.4, pp.549-53, especially, Fig.1 | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Conformation influences during the dehydrogenation of phenolic Mannich bases, Monatsh. Chem., 1974, Vol.105, No.6, pp.1151-63, especially, page 1156 | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | TITKOV, Yu.B. et al, Luminescence method for determining molybdenum with hydroxyquinoline and sodium tetraphenylborate, Ukr. Khim. Zh., 1970, Vol.36, No.6, pp.613-15, especially, page 614 | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | DOUGLASS, James E. et al, Some bis-amine complexes of boroniumions with bulky substituents of boron, J. Organomet. Chem., 1967, Vol.8, No.3, pp.421-6, especially, page 421 | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | DE, 1670494, A (Chemie Grünenthal GmbH), 21 January, 1971 (21.01.71) (Family: none) page 2, line 6 to page 4 | 1-12 |
| X Y | EP, 969531, A2 (Bayer Aktiengesellschaft), 05 January, 2000 (05.01.00), Par. Nos. [0046] to [0079]; Claim 10 & DE, 19829947, A1 | 6 |

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ A61K31/69, A61P33/02, C07F5/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), MEDLINE (STN), EMBASE (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|--|--------------------|
| X Y | TRUJILLO, Jose et al. X-ray crystallographic study of boroxazolidones obtained from L-ornithine, L-methionine, kainic acid and 2,6-pyridinedicarboxylic acid, J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 571, No. 1, pp. 21-29, 特に、第22ページ | 7, 8 1-5, 10-12 |
| X Y | HOPFL, Herbert et al. Study of cyclic borinates obtained from piperidine- and piperazine alcohols by spectroscopic methods and X-ray crystallography, J. Organomet. Chem., 1998, Vol. 553, No. 1-2, pp. 221-239, 特に、第222, 227ページ | 8 1-5, 10-12 |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

22.02.00

国際調査報告の発送日

29.02.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

滝田 下 浩

4C 9284

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|---|--------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X Y | DOROKHOV, V. A. et al, Boron chelate complexes with some enamines and diketones containing pyridine moiety and their mutual transformation in solutions, Izv. Akad. Nauk, Ser. Khim., 1996, No. 3, pp. 710-714, 特に、第712ページ | 7 1-5, 10-12 |
| X Y | Yuan, Guo-Zheng et al, Single site transarylation of 2,2'-dimetalized 1,1'-binaphthyl to aminochloroborates and synthesis of 2-binaphthyl boron compounds, Youji Huaxue, 1996, Vol. 16, No. 2, pp. 139-144, 特に、139, 140ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | U.S. 5,348,947, A (PATEL, Bomi P.) 20. 9月. 1994 (20. 09. 94) ファミリーなし 文献全体 | 7 1-5, 10-12 |
| X Y | U.S. 5,348,947, A (PATEL, Bomi P.) 20. 9月. 1994 (20. 09. 94) ファミリーなし 文献全体 | 7 1-5, 10-12 |
| X Y | TORRES, Luis Alfonso et al, Rotating-bomb combustion calorimetry and the standard enthalpies of formation of two borinic esters, J. Chem. Thermodyn. Vol. 1994, No. 26, No. 4, pp. 337-43, 特に、第338ページ | 7, 9 1-5, 10-12 |
| X Y | FARFAN, Norberto et al, Through-bond modulation of N.fwdarw. B ring formation shown by NMR and x-ray diffraction studies of borate derivatives of pyridyl alcohols, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2, 1992, No. 4, pp. 527-32, 特に、第527ページ | 7, 9 1-5, 10-12 |
| X Y | LIU, Xiaolan et al, Structure studies of bis(substituted)-2-(substituted)-8-hydroxyquinolines, Youji Huaxue, 1991, Vol. 11, No. 4, pp. 410-15, 特に、第412, 414ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | SHAN, Zixing et al, Synthesis of aromatic nitrogen-containing heterocyclic derivatives of asymmetric diarylborinic acids, Wuhan Daxue Xuebao, Ziran Kexueban, 1990, No. 3, pp. 67-72, 特に、第68ページ | 6, 7 1-5, 10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Ligand substitution reaction of diarylboron chelates, Wuji Huaxue Xuebao, 1990, Vol. 6, No. 3, pp. 314-18, 特に、第314, 315ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Studies on antitumor boron compounds. V. Fluorine- and methoxy-substituted diphenylboron chelates with N,O-bidentate ligands, Youji Huaxue, 1989, Vol. 9, No. 3, pp. 226-9, 特に、第227ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | YUAN, Guozheng et al, Boron compounds. XX. Synthesis and conversion of ethanolamine-tri(2-furyl)borane, Youji Huaxue 1987, No. 2, pp. 146-9, 特に、第148ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Concurrent reaction of the phenol and the 1,3-dicarbonyl function under Mannich conditions, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 11, pp. 767-71, 特に、第767ページ | 6 1-5, 10-12 |

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|--|----------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Reaction of functional epoxycarbonyl compounds opposed to hydrogen chloride, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 6, pp. 387-93, 特に、第389ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Real structures of drugs seemingly derived from 1-(8-hydroxyquinol-5-yl)-3-phenylpropane-1, 3-dione, Pharmazie, 1985, Vol. 40, No. 5, pp. 307-11, 特に、第309ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | LIN, Kai et al, Synthesis and antitumor activity of organyloxy-diarylborane chelates containing quinoline ring, Yiyao Gongye, 1985, Vol. 16, No. 11, pp. 500-2, 特に、第501ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | BAILEY, P. J. et al, Boron-containing antibacterial agents: effects on growth and morphology of bacteria under various culture conditions, Antimicrob. Agents Chemother., 1980, Vol. 17, No. 4, pp. 549-53, 特に、Fig. 1. | 6, 10 1-5, 11, 12 |
| X Y | MOEHRLE, H. et al, Conformation influences during the dehydrogenation of phenolic Mannich bases, Monatsh. Chem., 1974, Vol. 105, No. 6, pp. 1151-63, 特に、第1156ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | TITKOV, Yu. B. et al, Luminescence method for determining molybdenum with hydroxyquinoline and sodium tetraphenylborate, Ukr. Khim. Zh., 1970, Vol. 36, No. 6, pp. 613-15, 特に、第614ページ | 6 1-5, 10-12 |
| X Y | DOUGLASS, James E. et al, Some bis-amine complexes of boronium ions with bulky substituents of boron, J. Organomet. Chem., 1967, Vol. 8, No. 3, pp. 421-6, 特に、第421ページ | 6 1-5, 10-12 |
| Y | DE, 1 6 7 0 4 9 4, A (Chemie Gr. nenthal GmbH) 2 1. 1 月. 1 9 7 1 (2 1. 0 1. 7 1) ファミリーなし 第2ページ 第6行-第4ページ | 1-12 |
| PX | EP, 9 6 9 5 3 1, A 2 (Bayer Aktiengesellschaft) 0 5. 1 月. 2 0 0 0 (0 5. 0 1. 0 0) [0046]-[0079], CLAIM 10 & DE, 1 9 8 2 9 9 4 7, A 1 | 6 |